

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
24. Januar 2002 (24.01.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/06233 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 213/64**,
213/69, 413/04, 417/04, A01N 43/76, 43/78, 43/40

WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82,
67283 Obrigheim (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/08251

(74) Anwälte: **KINZEBACH, Werner** usw.; Ludwigsplatz 4,
67059 Ludwigshafen (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:
17. Juli 2001 (17.07.2001)

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ,
LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN,
MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI,
SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU,
ZA, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 34 838.6 18. Juli 2000 (18.07.2000) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): **BASF AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE];
67056 Ludwigshafen (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **SAGASSER, Ingo**
[DE/DE]; Schlesienstrasse 13, 67125 Dannstadt-Schauern-
heim (DE). **MENKE, Olaf** [DE/DE]; Lerchenweg 3,
67317 Altleiningen (DE). **HAMPRECHT, Gerhard**
[DE/DE]; Rote-Turm-Strasse 28, 69469 Weinheim
(DE). **PUHL, Michael** [DE/DE]; Bürstädter Strasse
95, 68623 Lampertheim (DE). **REINHARD, Robert**
[DE/DE]; Pranchstrasse 41, 67061 Ludwigshafen (DE).
WITSCHEL, Matthias [DE/DE]; Höhenweg 12b,
67098 Bad Dürkheim (DE). **ZAGAR, Cyrill** [DE/DE];
Georg-Herwegh-Strasse 31, 67061 Ludwigshafen (DE).

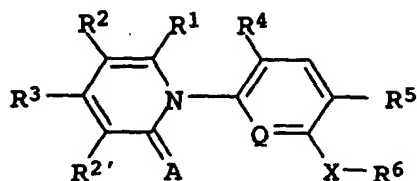
Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: 1-ARYL-4-ALKYL HALIDE-2(1H)-PYRIDONES AND THEIR USE AS HERBICIDES

(54) Bezeichnung: 1-ARYL-4-HALOGENALKYL-2(1H)-PYRIDONE UND IHRE VERWENDUNG ALS HERBIZIDE



(I)

(57) Abstract: The invention
relates to the use of 1-aryl-4-alkyl
halide-2-1H-pyridones of the general
formula (I), wherein the variables are
defined as per claim 1, and to their use
as herbicides.

(57) Zusammenfassung: Verwendung
von 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-py-

ridonen der allgemeinen Formel (I), worin die Variablen die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und ihre Verwendung
als Herbizide.



WO 02/06233 A1

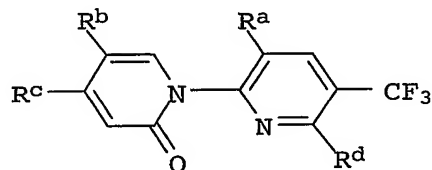
1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von

- 5 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridonen und von deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze sowie als Herbizide, Desikkantien oder Defoliantien.

- 1-Aryl-2-[1H]-pyridone wurden verschiedentlich als Wirksubstanzen
 10 in Mitteln zur Bekämpfung tierischer Schädlinge (Pestizide) beschrieben. Die EP-A 272 824 betrifft beispielsweise Pestizide, die 1-(2-Pyridyl)-2-[1H]-pyridone als Wirkstoff enthalten. Es werden unter anderem 1-(2-Pyridyl)-2-[1H]-pyridone der allgemeinen Formel

15



20

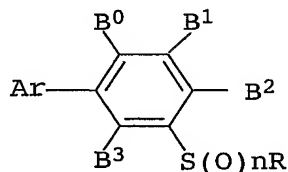
beschrieben, worin

- R^a für Wasserstoff, Chlor, Brom, Nitro, Amino oder Trifluormethyl;
 25 R^b für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Trifluormethyl;
 R^c C₁-C₄-Halogenalkyl; und
 R^d vorzugsweise Wasserstoff bedeuten.

- 30 Die EP-A 259 048 beschreibt Pestizide auf Basis von 1-Phenyl-2-[1H]-pyridonen, die vorzugsweise in der 2- und der 6-Position des Phenylrings ein Halogenatom tragen.

- Die WO 99/55668 beschreibt insektizid und mitizid wirkende Verbindungen der allgemeinen Formel,

40



worin

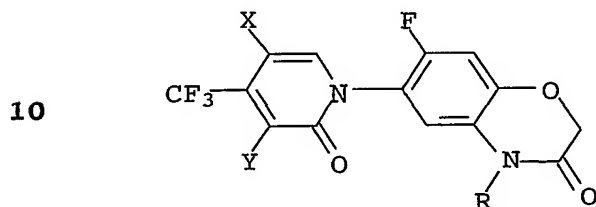
- 45 R für Alkyl, Alkenyl, Alkynyl und vergleichbare Reste steht,
 B⁰ bis B³ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano Halogenalkyl oder vergleichbare Reste stehen;

2

n 0, 1 oder 2 bedeutet; und

Ar einen aromatischen Rest, unter anderem einen 1H-2-Pyridon-1-yl-rest, bedeutet.

5 Die EP-A 488220 beschreibt herbizid wirkende Verbindungen der allgemeinen Formel,



15 worin

R unter anderem für Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Halogenalkyl und vergleichbare Reste steht,

X Wasserstoff, Halogen, Methyl oder Ethyl, das mit Halogen substituiert sein kann; und

20 Y Wasserstoff oder Methyl bedeutet.

Prinzipiell besteht ein ständiges Bedürfnis an der Bereitstellung neuer herbizid wirksamer Substanzen, um eine mögliche Resistenzbildung gegen bekannte Herbizide zu umgehen.

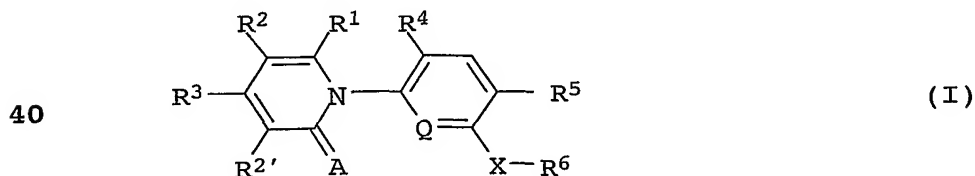
25

Der vorliegenden Erfindung liegt somit die Aufgabe zugrunde, neue Herbizide bereitzustellen, mit denen sich Schadpflanzen besser als bisher bekämpfen lassen. Die neuen Herbizide sollen vorteilhafterweise eine hohe Aktivität gegenüber Schadpflanzen aufwei-

30 sen. Außerdem ist eine Kulturpflanzenverträglichkeit gewünscht.

Diese Aufgabe wird durch 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone der nachfolgend definierten Formel I gelöst.

35 Die vorliegende Erfindung betrifft daher die Verwendung von 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridonen der allgemeinen Formel I



45 worin die Variablen A, X, Q, R¹, R², R^{2'}, R³, R⁴, R⁵ und R⁶ folgende Bedeutung haben:

3

- R¹ Wasserstoff oder Halogen;
- R² und R^{2'} unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino oder C₁-C₄-Alkyl;
- 5 R³ C₁-C₄-Halogenalkyl;
- R⁴ Wasserstoff oder Halogen;
- 10 R⁵ Wasserstoff, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
- A Sauerstoff oder Schwefel;
- 15 X eine chemische Bindung, Methylen, 1,2-Ethylen, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,2-diyl, Ethin-1,2-diyl oder über das Heteroatom an den Phenylring gebundenes Oxymethylen oder Thiamethylen, wobei alle Gruppen unsubstituiert sein oder einen oder zwei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt
- 20 aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, Di-(C₁-C₄-Alkyl)amino und Phenyl;
- R⁶ Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, Halogensulfonyl, -O-Y-R⁸,
 25 -O-CO-Y-R⁸, -N(Y-R⁸)(Z-R⁹), -N(Y-R⁸)-SO₂-Z-R⁹,
 -N(SO₂-Y-R⁸)(SO₂-Z-R⁹), -N(Y-R⁸)-CO-Z-R⁹, -N(Y-R⁸)(O-Z-R⁹),
 -S(O)_n-Y-R⁸ mit n = 0, 1 oder 2, -SO₂-O-Y-R⁸,
 -SO₂-N(Y-R⁸)(Z-R⁹), -CO-Y-R⁸, -C(=NOR¹⁰)-Y-R⁸,
 -C(=NOR¹⁰)-O-Y-R⁸, -CO-O-Y-R⁸, -CO-S-Y-R⁸, -CO-N(Y-R⁸)(Z-R⁹),
 30 -CO-N(Y-R⁸)(O-Z-R⁹) oder -PO(O-Y-R⁸)₂;
- Q Stickstoff oder eine Gruppe C-R⁷, worin R⁷ für Wasserstoff, OH, SH oder NH₂ steht; oder
- 35 X-R⁶ und R⁷ eine 3- oder 4-gliedrige Kette, deren Kettenglieder neben Kohlenstoff 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter Stickstoff-, Sauerstoff- und Schwefelatomen, aufweisen können, die unsubstituiert sein oder ihrerseits einen, zwei oder
- 40 drei Substituenten tragen kann, und deren Glieder auch ein oder zwei nicht benachbarte Carbonyl-, Thiocarbonyl- oder Sulfonyl-Gruppen umfassen können,

worin die Variablen Y, Z, R⁸, R⁹ und R¹⁰ die nachfolgend angegebenen Bedeutungen haben:

45

Y, Z unabhängig voneinander:

4

eine chemische Bindung, Methylen oder 1,2-Ethylen, die unsubstituiert sein oder einen oder zwei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Carboxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl und Phenyl;

R⁸, R⁹ unabhängig voneinander:

Wasserstoff, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, -CH(R¹¹)(R¹²), -C(R¹¹)(R¹²)-NO₂, -C(R¹¹)(R¹²)-CN, -C(R¹¹)(R¹²)-Halogen, -C(R¹¹)(R¹²)-OR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-N(R¹³)R¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-N(R¹³)-OR¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-SR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-SO-R¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-SO₂-R¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-SO₂-OR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-SO₂-N(R¹³)R¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-R¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-C(=NOR¹⁵)-R¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-OR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-SR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-N(R¹³)R¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-N(R¹³)-OR¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-PO(OR¹³)₂, C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, das ein Carbonyl- oder Thiocarbonyl-Ringglied enthalten kann, Phenyl oder 3-, 4-, 5-, 6- oder 7-gliedriges Heterocyclyl, das ein Carbonyl- oder Thiocarbonyl-Ringglied enthalten kann, wobei jeder Cycloalkyl-, der Phenyl- und jeder Heterocyclyl-Ring unsubstituiert sein oder ein, zwei, drei oder vier Substituenten tragen kann, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, (C₁-C₄-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkyl)carbonyloxy, (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyloxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl und Di-(C₁-C₄-Alkyl)amino;

R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl;

wobei die Variablen R¹¹ bis R¹⁵ die folgenden Bedeutungen aufweisen:

R¹¹, R¹² unabhängig voneinander

Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl, wobei der Phenylring unsubstituiert sein oder ein bis drei Substituenten tragen, jeweils

5

ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Nitro, Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl und (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl;

- 5 R¹³, R¹⁴ unabhängig voneinander
 Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, 3-
 10 bis 7-gliedriges Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, wobei jeder Cycloalkyl- und jeder Heterocyclyl-Ring ein Carbonyl- oder Thiocarbonyl-Ringglied enthalten kann, und wobei jeder Cycloalkyl-, der Phenyl- und jeder Heterocyclyl-Ring unsubstituiert sein oder ein bis vier
 15 Substituenten tragen kann, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl,
 20 (C₁-C₄-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkyl)carbonyloxy, (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyloxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl und Di-(C₁-C₄-Alkyl)amino;
- R¹⁵ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl,
 25 C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl;

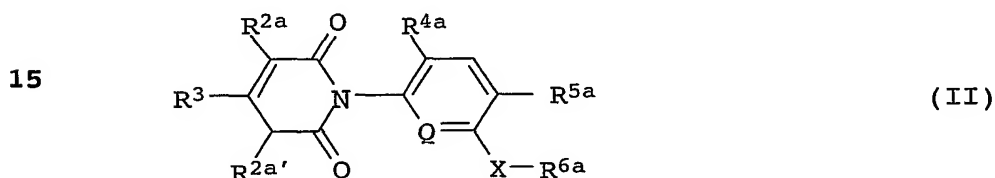
und von deren landwirtschaftlich brauchbaren Salzen als Herbizide und/oder zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen.

- 30 Weiterhin betrifft die vorliegende Erfindung die Verbindungen der zuvor definierten allgemeinen Formel I und ihre landwirtschaftlich brauchbaren Salze, wobei von den beanspruchten Verbindungen solche Verbindungen der Formel I ausgenommen sind, worin A für
 35 Sauerstoff, Q für CH, R³ und R⁵ für Trifluormethyl stehen, und R¹, R², R^{2'}, R⁴ und X-R⁶ Wasserstoff bedeuten; oder worin A für Sauerstoff und Q für N stehen, R³ und R⁴ die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen, R¹, R² und R^{2'} Wasserstoff bedeuten und X-R⁶ für Wasserstoff oder Halogen steht, wenn R⁵ Trifluormethyl
 40 bedeutet. Weiterhin ausgenommen sind Verbindungen der Formel I, worin A für Sauerstoff, Q für CH und R³ für Trifluormethyl stehen, R¹, R², R^{2'}, R⁴ Wasserstoff bedeuten und X-R⁶ für eine Gruppe S(O)_n-Y-R⁸ mit n = 0, 1 oder 2 steht, worin Y eine Einfachbindung bedeutet und R⁸ ausgewählt ist unter n-Propyl, Isopropyl,
 45 Cyclopropylmethyl und 2,2,2-Trifluorethyl.

Außerdem betrifft die Erfindung:

6

- herbizide Mittel und Mittel zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen, welche die Verbindungen I als wirksame Substanzen enthalten,
- Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I und von herbiziden Mitteln und Mitteln zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen unter Verwendung der Verbindungen I, sowie
- Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs (Schadpflanzen) und zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen mit den Verbindungen I,
- Verbindungen der allgemeinen Formel II,



20

worin R^3 , X und Q die oben genannten Bedeutungen haben und R^{2a} , $R^{2a'}$, R^{4a} , R^{5a} , R^{6a} für R^2 , $R^{2'}$, R^4 , R^5 und R^6 mit den oben genannten Bedeutungen stehen,

- ausgenommen Verbindungen der allgemeinen Formel II,
- 25 worin Q für CH steht, R^3 und R^{5a} Trifluormethyl bedeuten und R^{2a} , $R^{2a'}$, R^{4a} und X- R^{6a} Wasserstoff bedeuten;
- weiterhin ausgenommen Verbindungen der allgemeinen Formel II, worin Q für N steht, R^3 und R^{4a} die oben für R^3 bzw. R^4 angegebene Bedeutung haben, R^{2a} und $R^{2a'}$ Wasserstoff bedeuten,
- 30 X- R^{6a} für Wasserstoff oder Halogen stehen, wenn R^{5a} Trifluormethyl bedeutet,
- weiterhin ausgenommen Verbindungen der allgemeinen Formel II mit Q = CH und R^3 = Trifluormethyl, wenn R^{2a} , $R^{2a'}$ und R^{4a} Wasserstoff bedeuten, R^{5a} die oben für R^5 angegebene Bedeutung
- 35 hat, X eine Einfachbindung bedeutet und R^6 für eine Gruppe $S(O)_n-YR^8$ steht mit $n = 0, 1$ oder 2 , worin Y eine Einfachbindung bedeutet und R^8 ausgewählt ist unter n-Propyl, Isopropyl, Cyclopropylmethyl und 2,2,2-Trifluorethyl, sowie die Tautomeren der Verbindungen II.

40

Die Verbindungen der Formel I können in den Substituenten ein oder mehrere Chiralitätszentren aufweisen und liegen dann als Enantiomeren- oder Diastereomeregemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren

45 als auch deren Gemische.

7

Unter landwirtschaftlich brauchbaren Salzen kommen vor allem die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen beziehungsweise Anionen die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen. So kommen als Kationen insbesondere die Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium, Magnesium und Barium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie das Ammoniumion, das gewünschtenfalls ein bis vier C₁-C₄-Alkylsubstituenten und/oder einen Phenyl- oder Benzylsubstituenten tragen kann, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Phosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat, sowie die Anionen von C₁-C₄-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat. Sie können durch Reaktion von I mit einer Säure des entsprechenden Anions, vorzugsweise der Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salpetersäure, gebildet werden.

Die bei der Definition der Substituenten R², R^{2'}, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ bis R¹⁹ oder als Reste an Cycloalkyl-, Phenyl- oder heterocyclischen Ringen genannten organischen Molekülteile stellen - wie die Bedeutung Halogen - Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenstoffketten, also alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Alkylsulfinyl-, Halogenalkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Halogenalkylsulfonyl-, Alkenyl-, Halogenalkenyl-, Alkinyl- und Halogenalkinyl-Gruppen sowie entsprechende Gruppenteile in größeren Gruppen wie Alkoxycarbonyl, Phenylalkyl-, Cycloalkylalkyl, Alkoxycarbonylalkyl etc. können geradkettig oder verzweigt sein, wobei das Präfix C_n-C_m jeweils die mögliche Anzahl von Kohlenstoffatomen in der Gruppe angibt. Halogenierte Substituenten tragen vorzugsweise ein, zwei, drei, vier oder fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

Ferner stehen beispielsweise:

8

- C₁-C₄-Alkyl für: CH₃, C₂H₅, n-Propyl, CH(CH₃)₂, n-Butyl, CH(CH₃)-C₂H₅, CH₂-CH(CH₃)₂ und C(CH₃)₃;

- 5 - C₁-C₄-Halogenalkyl für: einen C₁-C₄-Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. CH₂F, CHF₂, CF₃, CH₂Cl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl, 2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 10 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, C₂F₅, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 15 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl oder Nonafluorbutyl;

- 20 - C₁-C₆-Alkyl für: C₁-C₄-Alkyl wie vorstehend genannt, sowie z.B. n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 25 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl oder 30 1-Ethyl-2-methylpropyl, vorzugsweise Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, n-Butyl, 1,1-Dimethylethyl, n-Pentyl oder n-Hexyl;

- C₁-C₆-Halogenalkyl für: einen C₁-C₆-Alkylrest wie vorstehend 35 genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. einen der unter C₁-C₄-Halogenalkyl genannten Reste sowie für 5-Fluor-1-pentyl, 5-Chlor-1-pentyl, 5-Brom-1-pentyl, 5-Iod-1-pentyl, 5,5,5-Trichlor-1-pentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluor-1-hexyl, 40 6-Chlor-1-hexyl, 6-Brom-1-hexyl, 6-Iod-1-hexyl, 6,6,6-Trichlor-1-hexyl oder Dodecafluorhexyl;

- Phenyl-C₁-C₄-alkyl für: Benzyl, 1-Phenylethyl, 2-Phenylethyl, 1-Phenylprop-1-yl, 2-Phenylprop-1-yl, 3-Phenylprop-1-yl, 45 1-Phenylbut-1-yl, 2-Phenylbut-1-yl, 3-Phenylbut-1-yl, 4-Phenylbut-1-yl, 1-Phenylbut-2-yl, 2-Phenylbut-2-yl, 3-Phenylbut-2-yl, 4-Phenylbut-2-yl,

9

1-(Phenylmethyl)-eth-1-yl,
 1-(Phenylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl oder
 1-(Phenylmethyl)-prop-1-yl, vorzugsweise Benzyl oder
 2-Phenylethyl;

5

- Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl für: Heterocyclylmethyl,
 1-Heterocyclyl-ethyl, 2-Heterocyclyl-ethyl,
 1-Heterocyclyl-prop-1-yl, 2-Heterocyclyl-prop-1-yl,
 3-Heterocyclyl-prop-1-yl, 1-Heterocyclyl-but-1-yl,
 2-Heterocyclyl-but-1-yl, 3-Heterocyclyl-but-1-yl,
 4-Heterocyclyl-but-1-yl, 1-Heterocyclyl-but-2-yl,
 2-Heterocyclyl-but-2-yl, 3-Heterocyclyl-but-2-yl,
 3-Heterocyclyl-but-2-yl, 4-Heterocyclyl-but-2-yl,
 1-(Heterocyclyl-methyl)-eth-1-yl,
 1-(Heterocyclylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl oder
 1-(Heterocyclylmethyl)-prop-1-yl, vorzugsweise
 Heterocyclylmethyl oder 2-Heterocyclyl-ethyl;

10

15

20

- C₁-C₄-Alkoxy für: OCH₃, OC₂H₅, n-Propoxy, OCH(CH₃)₂, n-Butoxy,
 OCH(CH₃)-C₂H₅, OCH₂-CH(CH₃)₂ oder OC(CH₃)₃, vorzugsweise für
 OCH₃, OC₂H₅ oder OCH(CH₃)₂;

25

30

35

40

- C₁-C₄-Halogenalkoxy für: einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie vorstehend
 genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,
 Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. OCH₂F, OCHF₂,
 OCF₃, OCH₂Cl, OCH(Cl)₂, OC(Cl)₃, Chlorfluormethoxy,
 Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy, 2-Fluorethoxy,
 2-Chlorethoxy, 2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy,
 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy,
 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy,
 2,2,2-Trichlorethoxy, OC₂F₅, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy,
 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy,
 3-Chlorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 2-Brompropoxy,
 3-Brompropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy,
 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, OCF₂-C₂F₅,
 1-(CH₂F)-2-fluorethoxy, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethoxy,
 1-(CH₂Br)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy,
 4-Brombutoxy oder Nonafluorbutoxy, vorzugsweise für OCHF₂,
 OCF₃, Dichlorfluormethoxy, Chlordifluormethoxy oder
 2,2,2-Trifluorethoxy;

45

- C₁-C₆-Alkylthio für: SCH₃, SC₂H₅, n-Propylthio, SCH(CH₃)₂,
 n-Butylthio, SCH(CH₃)-C₂H₅, SCH₂-CH(CH₃)₂ oder SC(CH₃)₃, vor-
 zugsweise für SCH₃ oder SC₂H₅;

10

- C₁-C₄-Halogenalkylthio für: einen C₁-C₄-Alkylthioest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. SCH₂F, SCHF₂, SCH₂Cl, SCH(Cl)₂, SC(Cl)₃, SCF₃,
 5 Chlorfluormethylthio, Dichlorfluormethylthio, Chlordifluormethylthio, 2-Fluorethylthio, 2-Chlorethylthio, 2-Bromethylthio, 2-Iodethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio, 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio,
 10 2,2,2-Trichlorethylthio, SC₂F₅, 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio, 2,2-Difluorpropylthio, 2,3-Difluorpropylthio, 2-Chlorpropylthio, 3-Chlorpropylthio, 2,3-Dichlorpropylthio, 2-Brompropylthio, 3-Brompropylthio, 3,3,3-Trifluorpropylthio, 3,3,3-Trichlorpropylthio, SCH₂-C₂F₅,
 15 SCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluorethylthio, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethylthio, 1-(CH₂Br)-2-bromethylthio, 4-Fluorbutylthio, 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio oder SCF₂-CF₂-C₂F₅, vorzugsweise für SCHF₂, SCF₃, Dichlorfluormethylthio, Chlordifluormethylthio oder
 20 2,2,2-Trifluorethylthio;

- C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl für: durch C₁-C₄-Alkoxy - wie vorstehend genannt - substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für CH₂-OCH₃, CH₂-OC₂H₅, n-Propoxymethyl, CH₂-OCH(CH₃)₂,
 25 n-Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl, (2-Methylpropoxy)methyl, CH₂-OC(CH₃)₃, 2-(Methoxy)ethyl, 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(n-Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(n-Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl,
 30 2-(Methoxy)propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(n-Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)propyl, 2-(n-Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl, 3-(Ethoxy)propyl, 3-(n-Propoxy)propyl,
 35 3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(n-Butoxy)propyl, 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)butyl, 2-(Ethoxy)butyl, 2-(n-Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl, 2-(n-Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl,
 40 2-(2-Methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)butyl, 3-(n-Propoxy)butyl, 3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(n-Butoxy)butyl, 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl, 3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)butyl,
 45 4-(Ethoxy)butyl, 4-(n-Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl, 4-(n-Butoxy)butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl, 4-(2-Methylpropoxy)butyl oder 4-(1,1-Dimethylethoxy)butyl,

11

vorzugsweise für $\text{CH}_2\text{-OCH}_3$, $\text{CH}_2\text{-OC}_2\text{H}_5$, 2-Methoxyethyl oder 2-Ethoxyethyl;

- 5 - $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylthio-C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$ für: durch $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkylthio}$ - wie vorstehend genannt - substituiertes $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$, also z.B. für $\text{CH}_2\text{-SCH}_3$, $\text{CH}_2\text{-SC}_2\text{H}_5$, n-Propylthiomethyl, $\text{CH}_2\text{-SCH(CH}_3)_2$, n-Butylthiomethyl, (1-Methylpropylthio)methyl, (2-Methylpropylthio)methyl, $\text{CH}_2\text{-SC(CH}_3)_2$, 2-(Methylthio)ethyl, 2-(Ethylthio)ethyl, 2-(n-Propylthio)ethyl,

10 2-(1-Methylethylthio)ethyl, 2-(n-Butylthio)ethyl, 2-(1-Methylpropylthio)ethyl, 2-(2-Methylpropylthio)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethylthio)ethyl, 2-(Methylthio)propyl, 2-(Ethylthio)propyl, 2-(n-Propylthio)propyl, 2-(1-Methylethylthio)propyl, 2-(n-Butylthio)propyl,

15 2-(1-Methylpropylthio)propyl, 2-(2-Methylpropylthio)propyl, 2-(1,1-Dimethylethylthio)propyl, 3-(Methylthio)propyl, 3-(Ethylthio)propyl, 3-(n-Propylthio)propyl, 3-(1-Methylethylthio)propyl, 3-(n-Butylthio)propyl, 3-(1-Methylpropylthio)propyl, 3-(2-Methylpropylthio)propyl,

20 3-(1,1-Dimethylethylthio)propyl, 2-(Methylthio)butyl, 2-(Ethylthio)butyl, 2-(n-Propylthio)butyl, 2-(1-Methylethylthio)butyl, 2-(n-Butylthio)butyl, 2-(1-Methylpropylthio)butyl, 2-(2-Methylpropylthio)butyl, 2-(1,1-Dimethylethylthio)butyl, 3-(Methylthio)butyl,

25 3-(Ethylthio)butyl, 3-(n-Propylthio)butyl, 3-(1-Methylethylthio)butyl, 3-(n-Butylthio)butyl, 3-(1-Methylpropylthio)butyl, 3-(2-Methylpropylthio)butyl, 3-(1,1-Dimethylethylthio)butyl, 4-(Methylthio)butyl, 4-(Ethylthio)butyl, 4-(n-Propylthio)butyl,

30 4-(1-Methylethylthio)butyl, 4-(n-Butylthio)butyl, 4-(1-Methylpropylthio)butyl, 4-(2-Methylpropylthio)butyl oder 4-(1,1-Dimethylethylthio)butyl, vorzugsweise $\text{CH}_2\text{-SCH}_3$, $\text{CH}_2\text{-SC}_2\text{H}_5$, 2-Methylthioethyl oder 2-Ethylthioethyl;
- 35 - $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl})\text{carbonyl}$ für: CO-CH_3 , $\text{CO-C}_2\text{H}_5$, $\text{CO-CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{CO-CH(CH}_3)_2$, n-Butylcarbonyl, $\text{CO-CH(CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{CO-CH}_2\text{-CH(CH}_3)_2$ oder $\text{CO-C(CH}_3)_3$, vorzugsweise für CO-CH_3 oder $\text{CO-C}_2\text{H}_5$;
- 40 - $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Halogenalkyl})\text{carbonyl}$ für: einen $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl})\text{carbonylrest}$ - wie vorstehend genannt - der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. $\text{CO-CH}_2\text{F}$, CO-CHF_2 , CO-CF_3 , $\text{CO-CH}_2\text{Cl}$, CO-CH(Cl)_2 , CO-C(Cl)_3 , Chlorfluormethylcarbonyl, Dichlorfluormethylcarbonyl, Chlordifluormethylcarbonyl,

45 2-Fluorethylcarbonyl, 2-Chlorethylcarbonyl, 2-Bromethylcarbonyl, 2-Iodethylcarbonyl, 2,2-Difluorethylcarbonyl, 2,2,2-Trifluorethylcarbonyl,

12

- 2-Chlor-2-fluorethylcarbonyl,
 2-Chlor-2,2-difluorethylcarbonyl,
 2,2-Dichlor-2-fluorethylcarbonyl,
 2,2,2-Trichlorethylcarbonyl, CO-C₂F₅, 2-Fluorpropylcarbonyl,
 5 3-Fluorpropylcarbonyl, 2,2-Difluorpropylcarbonyl,
 2,3-Difluorpropylcarbonyl, 2-Chlorpropylcarbonyl,
 3-Chlorpropylcarbonyl, 2,3-Dichlorpropylcarbonyl,
 2-Brompropylcarbonyl, 3-Brompropylcarbonyl,
 3,3,3-Trifluorpropylcarbonyl, 3,3,3-Trichlorpropylcarbonyl,
 10 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylcarbonyl, CO-CF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-
 fluorethylcarbonyl, 1-(CH₂Cl)-2-chlorethylcarbonyl,
 1-(CH₂Br)-2-bromethylcarbonyl, 4-Fluorbutylcarbonyl,
 4-Chlorbutylcarbonyl, 4-Brombutylcarbonyl oder
 Nonafluorbutylcarbonyl, vorzugsweise für CO-CF₃, CO-CH₂Cl,
 15 oder 2,2,2-Trifluorethylcarbonyl;
- (C₁-C₄-Alkyl)carbonyloxy für: O-CO-CH₃, O-CO-C₂H₅,
 O-CO-CH₂-C₂H₅, O-CO-CH(CH₃)₂, O-CO-CH₂-CH₂-C₂H₅,
 O-CO-CH(CH₃)-C₂H₅, O-CO-CH₂-CH(CH₃)₂ oder O-CO-C(CH₃)₃, vor-
 20 zugsweise für O-CO-CH₃ oder O-CO-C₂H₅;
- (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyloxy für: einen
 (C₁-C₄-Alkyl)carbonylrest - wie vorstehend genannt - der
 partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder
 25 Iod substituiert ist, also z.B. O-CO-CH₂F, O-CO-CHF₂,
 O-CO-CF₃, O-CO-CH₂Cl, O-CO-CH(Cl)₂, O-CO-C(Cl)₃,
 Chlorfluormethylcarbonyloxy, Dichlorfluormethylcarbonyloxy,
 Chlordifluormethylcarbonyloxy, 2-Fluorethylcarbonyloxy,
 2-Chlorethylcarbonyloxy, 2-Bromethylcarbonyloxy,
 30 2-Iodethylcarbonyloxy, 2,2-Difluorethylcarbonyloxy,
 2,2,2-Trifluorethylcarbonyloxy,
 2-Chlor-2-fluorethylcarbonyloxy,
 2-Chlor-2,2-difluorethylcarbonyloxy,
 2,2-Dichlor-2-fluorethylcarbonyloxy,
 35 2,2,2-Trichlorethylcarbonyloxy, O-CO-C₂F₅,
 2-Fluorpropylcarbonyloxy, 3-Fluorpropylcarbonyloxy,
 2,2-Difluorpropylcarbonyloxy, 2,3-Difluorpropylcarbonyloxy,
 2-Chlorpropylcarbonyloxy, 3-Chlorpropylcarbonyloxy,
 2,3-Dichlorpropylcarbonyloxy, 2-Brompropylcarbonyloxy,
 40 3-Brompropylcarbonyloxy, 3,3,3-Trifluorpropylcarbonyloxy,
 3,3,3-Trichlorpropylcarbonyloxy,
 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylcarbonyloxy,
 Heptafluorpropylcarbonyloxy,
 1-(CH₂F)-2-fluorethylcarbonyloxy,
 45 1-(CH₂Cl)-2-chlorethylcarbonyloxy,
 1-(CH₂Br)-2-bromethylcarbonyloxy, 4-Fluorbutylcarbonyloxy,
 4-Chlorbutylcarbonyloxy, 4-Brombutylcarbonyloxy oder

13

Nonafluorbutylcarbonyloxy, vorzugsweise für O-CO-CF₃,
O-CO-CH₂Cl oder 2,2,2-Trifluorethylcarbonyloxy;

- (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl für: CO-OCH₃, CO-OC₂H₅, n-Propoxy-
5 carbonyl, CO-OCH(CH₃)₂, n-Butoxycarbonyl, CO-OCH(CH₃)-C₂H₅,
CO-OCH₂-CH(CH₃)₂ oder CO-OC(CH₃)₃, vorzugsweise für CO-OCH₃
oder CO-OC₂H₅;

- (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl für: durch
10 (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl - wie vorstehend genannt -
substituiertes C₁-C₄-Alkyl, also z.B. für
Methoxycarbonyl-methyl, Ethoxycarbonyl-methyl,
n-Propoxycarbonyl-methyl, (1-Methylethoxycarbonyl)methyl,
n-Butoxycarbonylmethyl, (1-Methylpropoxycarbonyl)methyl,
15 (2-Methylpropoxycarbonyl)methyl,
(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)methyl, 1-(Methoxycarbonyl)ethyl,
1-(Ethoxycarbonyl)ethyl, 1-(n-Propoxycarbonyl)ethyl,
1-(1-Methylethoxycarbonyl)ethyl, 1-(n-Butoxycarbonyl)ethyl,
2-(Methoxycarbonyl)ethyl, 2-(Ethoxycarbonyl)ethyl,
20 2-(n-Propoxycarbonyl)ethyl, 2-(1-Methylethoxycarbonyl)ethyl,
2-(n-Butoxycarbonyl)ethyl, 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)ethyl,
2-(2-Methylpropoxycarbonyl)ethyl,
2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)ethyl,
2-(Methoxycarbonyl)propyl, 2-(Ethoxycarbonyl)propyl,
25 2-(n-Propoxycarbonyl)propyl,
2-(1-Methylethoxycarbonyl)propyl, 2-(n-Butoxycarbonyl)propyl,
2-(1-Methylpropoxycarbonyl)propyl,
2-(2-Methylpropoxycarbonyl)propyl,
2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propyl,
30 3-(Methoxycarbonyl)propyl, 3-(Ethoxycarbonyl)propyl,
3-(n-Propoxycarbonyl)propyl,
3-(1-Methylethoxycarbonyl)-propyl,
3-(n-Butoxycarbonyl)propyl,
3-(1-Methylpropoxycarbonyl)propyl,
35 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)propyl,
3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propyl,
2-(Methoxycarbonyl)-butyl, 2-(Ethoxycarbonyl)butyl,
2-(n-Propoxycarbonyl)butyl, 2-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl,
2-(n-Butoxycarbonyl)butyl, 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
40 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl,
3-(Methoxycarbonyl)butyl, 3-(Ethoxycarbonyl)butyl,
3-(n-Propoxycarbonyl)butyl, 3-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl,
3-(n-Butoxycarbonyl)butyl, 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
45 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl,
4-(Methoxycarbonyl)butyl, 4-(Ethoxycarbonyl)butyl,

14

- 4-(n-Propoxycarbonyl)butyl, 4-(1-Methylethoxycarbonyl)butyl,
 4-(n-Butoxycarbonyl)butyl, 4-(1-Methylpropoxycarbonyl)butyl,
 4-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl oder
 4-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butyl, vorzugsweise für
 5 Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl,
 1-(Methoxycarbonyl)ethyl oder 1-(Ethoxycarbonyl)ethyl;
- (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkoxy für: durch
 (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl - wie vorstehend genannt -
 10 substituiertes C₁-C₄-alkoxy, also z.B. für
 Methoxycarbonylmethoxy, Ethoxycarbonylmethoxy,
 n-Propoxycarbonylmethoxy, (1-Methylethoxycarbonyl)methoxy,
 n-Butoxycarbonylmethoxy, (1-Methylpropoxycarbonyl)methoxy,
 (2-Methylpropoxycarbonyl)methoxy,
 15 (1,1-Dimethylethoxycarbonyl)methoxy,
 1-(Methoxycarbonyl)ethoxy, 1-(Ethoxycarbonyl)ethoxy,
 1-(n-Propoxycarbonyl)ethoxy,
 1-(1-Methylethoxycarbonyl)ethoxy, 1-(n-Butoxycarbonyl)ethoxy,
 2-(Methoxycarbonyl)ethoxy, 2-(Ethoxycarbonyl)ethoxy,
 20 2-(n-Propoxycarbonyl)ethoxy,
 2-(1-Methylethoxycarbonyl)ethoxy, 2-(n-Butoxycarbonyl)ethoxy,
 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)ethoxy,
 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)ethoxy,
 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)ethoxy,
 25 2-(Methoxycarbonyl)propoxy, 2-(Ethoxycarbonyl)propoxy,
 2-(n-Propoxycarbonyl)propoxy,
 2-(1-Methylethoxycarbonyl)propoxy,
 2-(n-Butoxycarbonyl)propoxy,
 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)propoxy,
 30 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)propoxy,
 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propoxy,
 3-(Methoxycarbonyl)propoxy, 3-(Ethoxycarbonyl)propoxy,
 3-(n-Propoxycarbonyl)propoxy,
 3-(1-Methylethoxycarbonyl)propoxy,
 35 3-(n-Butoxycarbonyl)propoxy,
 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)propoxy,
 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)propoxy,
 3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propoxy,
 2-(Methoxycarbonyl)-butoxy, 2-(Ethoxycarbonyl)butoxy,
 40 2-(n-Propoxycarbonyl)butoxy,
 2-(1-Methylethoxycarbonyl)butoxy, 2-(n-Butoxycarbonyl)butoxy,
 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)butoxy,
 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)butoxy,
 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butoxy,
 45 3-(Methoxycarbonyl)butoxy, 3-(Ethoxycarbonyl)butoxy,
 3-(n-Propoxycarbonyl)butoxy,
 3-(1-Methylethoxycarbonyl)butoxy, 3-(n-Butoxycarbonyl)butoxy,

15

- 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)butoxy,
 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)butoxy,
 3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butoxy,
 4-(Methoxycarbonyl)butoxy, 4-(Ethoxycarbonyl)butoxy,
 5 4-(n-Propoxycarbonyl)butoxy,
 4-(1-Methylethoxycarbonyl)butoxy, 4-(n-Butoxycarbonyl)butoxy,
 4-(1-Methylpropoxycarbonyl)butoxy,
 4-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl oder
 4-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butoxy, vorzugsweise für
 10 Methoxycarbonylmethoxy, Ethoxycarbonylmethoxy,
 1-(Methoxycarbonyl)ethoxy oder 1-(Ethoxycarbonyl)ethoxy;
- (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkylthio für: durch
 (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl - wie vorstehend genannt -
 15 substituiertes C₁-C₄-alkylthio, also z.B. für
 Methoxycarbonylmethylthio, Ethoxycarbonylmethylthio,
 n-Propoxycarbonylmethylthio,
 (1-Methylethoxycarbonyl)methylthio,
 n-Butoxycarbonylmethylthio,
 20 (1-Methylpropoxycarbonyl)methylthio,
 (2-Methylpropoxycarbonyl)methylthio,
 (1,1-Dimethylethoxycarbonyl)methylthio,
 1-(Methoxycarbonyl)ethylthio, 1-(Ethoxycarbonyl)ethylthio,
 1-(n-Propoxycarbonyl)ethylthio,
 25 1-(1-Methylethoxycarbonyl)ethylthio,
 1-(n-Butoxycarbonyl)ethylthio, 2-(Methoxycarbonyl)ethylthio,
 2-(Ethoxycarbonyl)ethylthio, 2-(n-Propoxycarbonyl)ethylthio,
 2-(1-Methylethoxycarbonyl)ethylthio,
 2-(n-Butoxycarbonyl)ethylthio,
 30 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)ethylthio,
 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)ethylthio,
 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)ethylthio,
 2-(Methoxycarbonyl)propylthio, 2-(Ethoxycarbonyl)propylthio,
 2-(n-Propoxycarbonyl)propylthio,
 35 2-(1-Methylethoxycarbonyl)propylthio,
 2-(n-Butoxycarbonyl)propylthio,
 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)propylthio,
 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)propylthio,
 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propylthio,
 40 3-(Methoxycarbonyl)propylthio, 3-(Ethoxycarbonyl)propylthio,
 3-(n-Propoxycarbonyl)propylthio,
 3-(1-Methylethoxycarbonyl)propylthio,
 3-(n-Butoxycarbonyl)propylthio,
 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)propylthio,
 45 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)propylthio,
 3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)propylthio,
 2-(Methoxycarbonyl)-butylthio, 2-(Ethoxycarbonyl)butylthio,

16

- 2-(n-Propoxycarbonyl)butylthio,
 2-(1-Methylethoxycarbonyl)butylthio,
 2-(n-Butoxycarbonyl)butylthio,
 2-(1-Methylpropoxycarbonyl)butylthio,
 5 2-(2-Methylpropoxycarbonyl)butylthio,
 2-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butylthio,
 3-(Methoxycarbonyl)butylthio, 3-(Ethoxycarbonyl)butylthio,
 3-(n-Propoxycarbonyl)butylthio,
 3-(1-Methylethoxycarbonyl)butylthio,
 10 3-(n-Butoxycarbonyl)butylthio,
 3-(1-Methylpropoxycarbonyl)butylthio,
 3-(2-Methylpropoxycarbonyl)butylthio,
 3-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butylthio,
 4-(Methoxycarbonyl)butylthio, 4-(Ethoxycarbonyl)butylthio,
 15 4-(n-Propoxycarbonyl)butylthio,
 4-(1-Methylethoxycarbonyl)butylthio,
 4-(n-Butoxycarbonyl)butylthio,
 4-(1-Methylpropoxycarbonyl)butylthio,
 4-(2-Methylpropoxycarbonyl)butyl oder
 20 4-(1,1-Dimethylethoxycarbonyl)butylthio, vorzugsweise für
 Methoxycarbonylmethylthio, Ethoxycarbonylmethylthio,
 1-(Methoxycarbonyl)ethylthio oder
 1-(Ethoxycarbonyl)ethylthio;
- 25 - C₁-C₄-Alkylsulfinyl für: SO-CH₃, SO-C₂H₅, SO-CH₂-C₂H₅,
 SO-CH(CH₃)₂, n-Butylsulfinyl, SO-CH(CH₃)-C₂H₅, SO-CH₂-CH(CH₃)₂
 oder SO-C(CH₃)₃, vorzugsweise für SO-CH₃ oder SO-C₂H₅;
- C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl für: einen C₁-C₄-Alkylsulfinylrest
 30 - wie vorstehend genannt - der partiell oder vollständig
 durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also
 z.B. SO-CH₂F, SO-CHF₂, SO-CF₃, SO-CH₂Cl, SO-CH(Cl)₂,
 SO-C(Cl)₃, Chlorfluormethylsulfinyl,
 Dichlorfluormethylsulfinyl, Chlordifluormethylsulfinyl,
 35 2-Fluorethylsulfinyl, 2-Chlorethylsulfinyl,
 2-Bromethylsulfinyl, 2-Iodethylsulfinyl,
 2,2-Difluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl,
 2-Chlor-2-fluorethylsulfinyl,
 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfinyl,
 40 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfinyl,
 2,2,2-Trichlorethylsulfinyl, SO-C₂F₅, 2-Fluorpropylsulfinyl,
 3-Fluorpropylsulfinyl, 2,2-Difluorpropylsulfinyl,
 2,3-Difluorpropylsulfinyl, 2-Chlorpropylsulfinyl,
 3-Chlorpropylsulfinyl, 2,3-Dichlorpropylsulfinyl,
 45 2-Brompropylsulfinyl, 3-Brompropylsulfinyl,
 3,3,3-Trifluorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfinyl,
 SO-CH₂-C₂F₅, SO-CF₂-C₂F₅,

17

- 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfinyl,
 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfinyl,
 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfinyl, 4-Fluorbutylsulfinyl,
 4-Chlorbutylsulfinyl, 4-Brombutylsulfinyl oder
 5 Nonafluorbutylsulfinyl, vorzugsweise für $\text{SO}-\text{CF}_3$, $\text{SO}-\text{CH}_2\text{Cl}$ oder
 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl;
- C_1-C_4 -Alkylsulfonyl für: SO_2-CH_3 , $\text{SO}_2-\text{C}_2\text{H}_5$, $\text{SO}_2-\text{CH}_2-\text{C}_2\text{H}_5$,
 $\text{SO}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, n-Butylsulfonyl, $\text{SO}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}_2\text{H}_5$,
 10 $\text{SO}_2-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ oder $\text{SO}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_3$, vorzugsweise für SO_2-CH_3
 oder $\text{SO}_2-\text{C}_2\text{H}_5$;
- C_1-C_4 -Halogenalkylsulfonyl für: einen C_1-C_4 -Alkylsulfonylrest
 - wie vorstehend genannt - der partiell oder vollständig
 15 durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also
 z.B. $\text{SO}_2-\text{CH}_2\text{F}$, SO_2-CHF_2 , SO_2-CF_3 , $\text{SO}_2-\text{CH}_2\text{Cl}$, $\text{SO}_2-\text{CH}(\text{Cl})_2$,
 $\text{SO}_2-\text{C}(\text{Cl})_3$, Chlorfluormethylsulfonyl,
 Dichlorfluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl,
 2-Fluorethylsulfonyl, 2-Chlorethylsulfonyl,
 20 2-Bromethylsulfonyl, 2-Iodethylsulfonyl,
 2,2-Difluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl,
 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl,
 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl,
 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl,
 25 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, $\text{SO}_2-\text{C}_2\text{F}_5$, 2-Fluorpropylsulfonyl,
 3-Fluorpropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl,
 2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2-Chlorpropylsulfonyl,
 3-Chlorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl,
 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl,
 30 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl,
 $\text{SO}_2-\text{CH}_2-\text{C}_2\text{F}_5$, $\text{SO}_2-\text{CF}_2-\text{C}_2\text{F}_5$,
 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl,
 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl,
 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl,
 35 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfonyl oder
 Nonafluorbutylsulfonyl, vorzugsweise für SO_2-CF_3 , $\text{SO}_2-\text{CH}_2\text{Cl}$
 oder 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl;
- Di-(C_1-C_4 -Alkyl)amino für: $\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$,
 40 N,N-Dipropylamino, $\text{N}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]_2$, N,N-Dibutylamino,
 N,N-Di-(1-methylpropyl)amino, N,N-Di-(2-methylpropyl)amino,
 $\text{N}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]_2$, N-Ethyl-N-methylamino, N-Methyl-N-propylamino,
 N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-methylamino,
 N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino,
 45 N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino,
 N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino,

18

- N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino,
 N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,
 N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino,
 5 N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino,
 N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino,
 N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino,
 N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino,
 10 N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-
 N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino,
 N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,
 15 N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino oder
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino, vorzugsweise
 für $N(CH_3)_2$ oder $N(C_2H_5)$;
- 20 - Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-aminocarbonyl: z.B.
 N,N-Dimethylaminocarbonyl, N,N-Diethylaminocarbonyl,
 N,N-Di-(1-methylethyl)aminocarbonyl,
 N,N-Dipropylaminocarbonyl, N,N-Dibutylaminocarbonyl,
 N,N-Di-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 25 N,N-Di-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-methylaminocarbonyl,
 N-Methyl-N-propylaminocarbonyl,
 N-Methyl-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,
 30 N-Butyl-N-methylaminocarbonyl,
 N-Methyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Methyl-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-propylaminocarbonyl,
 35 N-Ethyl-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,
 N-Butyl-N-ethylaminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminocarbonyl,
 40 N-(1-Methylethyl)-N-propylaminocarbonyl,
 N-Butyl-N-propylaminocarbonyl,
 N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl,
 N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylaminocarbonyl,
 45 N-Butyl-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,
 N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,

19

- N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,
 N-Butyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Butyl-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminocarbonyl,
 5 N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl oder
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl;
- Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl: Durch
 10 Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl einfach substituiertes
 C₁-C₄-Alkyl, z.B. Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylmethyl, 1-
 oder 2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylethyl, 1-, 2- oder
 3-Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylpropyl;
- 15 - Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl-C₁-C₄-alkoxy: Durch
 Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl einfach substituiertes
 C₁-C₄-Alkoxy, z.B. Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylmethoxy, 1-
 oder 2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylethoxy, 1-, 2- oder
 3-Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylpropoxy;
- 20 - Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl-C₁-C₄-alkylthio: Durch
 Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonyl einfach substituiertes
 C₁-C₄-Alkylthio, z.B.
 Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylmethylthio, 1- oder
 25 2-Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylethylthio, 1-, 2- oder
 3-Di-(C₁-C₄-alkyl)-aminocarbonylpropylthio;
- C₂-C₆-Alkenyl für: Vinyl, Prop-1-en-1-yl, Allyl,
 1-Methylethenyl, 1-Buten-1-yl, 1-Buten-2-yl, 1-Buten-3-yl,
 30 2-Buten-1-yl, 1-Methyl-prop-1-en-1-yl,
 2-Methyl-prop-1-en-1-yl, 1-Methyl-prop-2-en-1-yl,
 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, n-Penten-1-yl, n-Penten-2-yl,
 n-Penten-3-yl, n-Penten-4-yl, 1-Methyl-but-1-en-1-yl,
 2-Methyl-but-1-en-1-yl, 3-Methyl-but-1-en-1-yl,
 35 1-Methyl-but-2-en-1-yl, 2-Methyl-but-2-en-1-yl,
 3-Methyl-but-2-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl,
 2-Methyl-but-3-en-1-yl, 3-Methyl-but-3-en-1-yl,
 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yl,
 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yl,
 40 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl, n-Hex-1-en-1-yl, n-Hex-2-en-1-yl,
 n-Hex-3-en-1-yl, n-Hex-4-en-1-yl, n-Hex-5-en-1-yl,
 1-Methyl-pent-1-en-1-yl, 2-Methyl-pent-1-en-1-yl,
 3-Methyl-pent-1-en-1-yl, 4-Methyl-pent-1-en-1-yl,
 1-Methyl-pent-2-en-1-yl, 2-Methyl-pent-2-en-1-yl,
 45 3-Methyl-pent-2-en-1-yl, 4-Methyl-pent-2-en-1-yl,
 1-Methyl-pent-3-en-1-yl, 2-Methyl-pent-3-en-1-yl,
 3-Methyl-pent-3-en-1-yl, 4-Methyl-pent-3-en-1-yl,

20

- 1-Methyl-pent-4-en-1-yl, 2-Methyl-pent-4-en-1-yl,
 3-Methyl-pent-4-en-1-yl, 4-Methyl-pent-4-en-1-yl,
 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl,
 5 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl,
 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl,
 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,
 10 1-Ethyl-but-1-en-1-yl, 1-Ethyl-but-2-en-1-yl,
 1-Ethyl-but-3-en-1-yl, 2-Ethyl-but-1-en-1-yl,
 2-Ethyl-but-2-en-1-yl, 2-Ethyl-but-3-en-1-yl,
 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl,
 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl,
 15 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yl oder
 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl;
- C₂-C₆-Halogenalkenyl für: C₂-C₆-Alkenyl wie vorstehend
 genannt, das partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor
 20 und/oder Brom substituiert ist, also z.B. 2-Chlorvinyl,
 2-Chlorallyl, 3-Chlorallyl, 2,3-Dichlorallyl,
 3,3-Dichlorallyl, 2,3,3-Trichlorallyl, 2,3-Dichlorbut-2-enyl,
 2-Bromallyl, 3-Bromallyl, 2,3-Dibromallyl, 3,3-Dibromallyl,
 2,3,3-Tribromallyl und 2,3-Dibrombut-2-enyl, vorzugsweise
 25 für C₃- oder C₄-Halogenalkenyl;
- C₂-C₆-Alkinyl für: Ethinyl und C₃-C₆-Alkinyl wie
 Prop-1-in-1-yl, Prop-2-in-1-yl, n-But-1-in-1-yl,
 n-But-1-in-3-yl, n-But-1-in-4-yl, n-But-2-in-1-yl,
 30 n-Pent-1-in-1-yl, n-Pent-1-in-3-yl, n-Pent-1-in-4-yl,
 n-Pent-1-in-5-yl, n-Pent-2-in-1-yl, n-Pent-2-in-4-yl,
 n-Pent-2-in-5-yl, 3-Methyl-but-1-in-3-yl, 3-Methyl-
 but-1-in-4-yl, n-Hex-1-in-1-yl, n-Hex-1-in-3-yl,
 n-Hex-1-in-4-yl, n-Hex-1-in-5-yl, n-Hex-1-in-6-yl,
 35 n-Hex-2-in-1-yl, n-Hex-2-in-4-yl, n-Hex-2-in-5-yl,
 n-Hex-2-in-6-yl, n-Hex-3-in-1-yl, n-Hex-3-in-2-yl,
 3-Methyl-pent-1-in-1-yl, 3-Methyl-pent-1-in-3-yl,
 3-Methyl-pent-1-in-4-yl, 3-Methyl-pent-1-in-5-yl,
 4-Methyl-pent-1-in-1-yl, 4-Methyl-pent-2-in-4-yl oder
 40 4-Methyl-pent-2-in-5-yl, vorzugsweise für Prop-2-in-1-yl;
- C₂-C₆-Halogenalkinyl für: C₂-C₆-Alkinyl wie vorstehend
 genannt, das partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor
 und/oder Brom substituiert ist, also z.B.
 45 1,1-Difluorprop-2-in-1-yl, 1,1-Difluorbut-2-in-1-yl,
 4-Fluorbut-2-in-1-yl, 4-Chlorbut-2-in-1-yl,

21

5-Fluorpent-3-in-1-yl oder 6-Fluorhex-4-in-1-yl, vorzugsweise C₃- oder C₄-Halogenalkinyl;

- 5 - C₃-C₈-Cycloalkyl für: Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl oder Cyclooctyl;
- 10 - C₃-C₈-Cycloalkyl, das ein Carbonyl- oder Thiocarbonyl-Ringglied enthält, z.B. für Cyclobutanon-2-yl, Cyclobutanon-3-yl, Cyclopentanon-2-yl, Cyclopentanon-3-yl, Cyclohexanon-2-yl, Cyclohexanon-4-yl, Cycloheptanon-2-yl, Cyclooctanon-2-yl, Cyclobutanthion-2-yl, Cyclobutanthion-3-yl, Cyclopentanthion-2-yl, Cyclopentanthion-3-yl, Cyclohexanthion-2-yl, Cyclohexanthion-4-yl, Cycloheptanthion-2-yl oder

15 Cyclooctanthion-2-yl, vorzugsweise für Cyclopentanon-2-yl oder Cyclohexanon-2-yl;
- 20 - C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl für: Cyclopropylmethyl, 1-Cyclopropyl-ethyl, 2-Cyclopropyl-ethyl, 1-Cyclopropyl-prop-1-yl, 2-Cyclopropyl-prop-1-yl, 3-Cyclopropyl-prop-1-yl, 1-Cyclopropyl-but-1-yl, 2-Cyclopropyl-but-1-yl, 3-Cyclopropyl-but-1-yl, 4-Cyclopropyl-but-1-yl, 1-Cyclopropyl-but-2-yl, 2-Cyclopropyl-but-2-yl,

25 3-Cyclopropyl-but-2-yl, 4-Cyclopropyl-but-2-yl, 1-(Cyclopropylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclopropylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclopropylmethyl)-prop-1-yl, Cyclobutylmethyl, 1-Cyclobutyl-ethyl, 2-Cyclobutyl-ethyl,

30 1-Cyclobutyl-prop-1-yl, 2-Cyclobutyl-prop-1-yl, 3-Cyclobutyl-prop-1-yl, 1-Cyclobutyl-but-1-yl, 2-Cyclobutyl-but-1-yl, 3-Cyclobutyl-but-1-yl, 4-Cyclobutyl-but-1-yl, 1-Cyclobutyl-but-2-yl, 2-Cyclobutyl-but-2-yl,

35 3-Cyclobutyl-but-2-yl, 4-Cyclobutyl-but-2-yl, 1-(Cyclobutylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclobutylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclobutylmethyl)-prop-1-yl, Cyclopentylmethyl, 1-Cyclopentyl-ethyl, 2-Cyclopentyl-ethyl,

40 1-Cyclopentyl-prop-1-yl, 2-Cyclopentyl-prop-1-yl, 3-Cyclopentyl-prop-1-yl, 1-Cyclopentyl-but-1-yl, 2-Cyclopentyl-but-1-yl, 3-Cyclopentyl-but-1-yl, 4-Cyclopentyl-but-1-yl, 1-Cyclopentyl-but-2-yl, 2-Cyclopentyl-but-2-yl, 3-Cyclopentyl-but-2-yl,

45 4-Cyclopentyl-but-2-yl, 1-(Cyclopentylmethyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclopentylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl, 1-(Cyclopentylmethyl)-prop-1-yl, Cyclohexylmethyl,

22

- 1-Cyclohexyl-ethyl, 2-Cyclohexyl-ethyl,
 1-Cyclohexyl-prop-1-yl, 2-Cyclohexyl-prop-1-yl,
 3-Cyclohexyl-prop-1-yl, 1-Cyclohexyl-but-1-yl,
 2-Cyclohexyl-but-1-yl, 3-Cyclohexyl-but-1-yl,
 5 4-Cyclohexyl-but-1-yl, 1-Cyclohexyl-but-2-yl,
 2-Cyclohexyl-but-2-yl,
 3-Cyclohexyl-but-2-yl, 4-Cyclohexyl-but-2-yl,
 1-(Cyclohexylmethyl)-eth-1-yl,
 1-(Cyclohexylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl,
 10 1-(Cyclohexylmethyl)-prop-1-yl, Cycloheptylmethyl,
 1-Cycloheptyl-ethyl, 2-Cycloheptyl-ethyl,
 1-Cycloheptyl-prop-1-yl, 2-Cycloheptyl-prop-1-yl,
 3-Cycloheptyl-prop-1-yl, 1-Cycloheptyl-but-1-yl,
 2-Cycloheptyl-but-1-yl, 3-Cycloheptyl-but-1-yl,
 15 4-Cycloheptyl-but-1-yl, 1-Cycloheptyl-but-2-yl,
 2-Cycloheptyl-but-2-yl,
 3-Cycloheptyl-but-2-yl, 4-Cycloheptyl-but-2-yl,
 1-(Cycloheptylmethyl)-eth-1-yl,
 1-(Cycloheptylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl,
 20 1-(Cycloheptylmethyl)-prop-1-yl, Cyclooctylmethyl,
 1-Cyclooctyl-ethyl, 2-Cyclooctyl-ethyl,
 1-Cyclooctyl-prop-1-yl, 2-Cyclooctyl-prop-1-yl,
 3-Cyclooctyl-prop-1-yl, 1-Cyclooctyl-but-1-yl,
 2-Cyclooctyl-but-1-yl, 3-Cyclooctyl-but-1-yl,
 25 4-Cyclooctyl-but-1-yl, 1-Cyclooctyl-but-2-yl,
 2-Cyclooctyl-but-2-yl,
 3-Cyclooctyl-but-2-yl, 4-Cyclooctyl-but-2-yl,
 1-(Cyclooctylmethyl)-eth-1-yl,
 1-(Cyclooctylmethyl)-1-(methyl)-eth-1-yl oder
 30 1-(Cyclooctylmethyl)-prop-1-yl, vorzugsweise für
 Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder
 Cyclohexylmethyl;
- C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, das ein Carbonyl- oder
 35 Thiocarbonyl-Ringglied enthält, z.B. für
 Cyclobutanon-2-ylmethyl, Cyclobutanon-3-ylmethyl,
 Cyclopentanon-2-ylmethyl, Cyclopentanon-3-ylmethyl,
 Cyclohexanon-2-ylmethyl, Cyclohexanon-4-ylmethyl,
 Cycloheptanon-2-ylmethyl, Cyclooctanon-2-ylmethyl,
 40 Cyclobutanthion-2-ylmethyl, Cyclobutanthion-3-ylmethyl,
 Cyclopentanthion-2-ylmethyl, Cyclopentanthion-3-ylmethyl,
 Cyclohexanthion-2-ylmethyl, Cyclohexanthion-4-ylmethyl,
 Cycloheptanthion-2-ylmethyl, Cyclooctanthion-2-ylmethyl,
 1-(Cyclobutanon-2-yl)ethyl, 1-(Cyclobutanon-3-yl)-ethyl,
 45 1-(Cyclopentanon-2-yl)ethyl, 1-(Cyclopentanon-3-yl)-ethyl,
 1-(Cyclohexanon-2-yl)ethyl, 1-(Cyclohexanon-4-yl)-ethyl,
 1-(Cycloheptanon-2-yl)ethyl, 1-(Cyclooctanon-2-yl)-ethyl,

23

- 1-(Cyclobutanthion-2-yl)ethyl, 1-(Cyclobutanthion-3-yl)ethyl,
 1-(Cyclopentanthion-2-yl)ethyl,
 1-(Cyclopentanthion-3-yl)ethyl,
 1-(Cyclohexanthion-2-yl)ethyl, 1-(Cyclohexanthion-4-yl)ethyl,
 5 1-(Cycloheptanthion-2-yl)ethyl,
 1-(Cyclooctanthion-2-yl)ethyl, 2-(Cyclobutanon-2-yl)ethyl,
 2-(Cyclobutanon-3-yl)ethyl, 2-(Cyclopentanon-2-yl)ethyl,
 2-(Cyclopentanon-3-yl)ethyl, 2-(Cyclohexanon-2-yl)ethyl,
 2-(Cyclohexanon-4-yl)ethyl, 2-(Cycloheptanon-2-yl)ethyl,
 10 2-(Cyclooctanon-2-yl)ethyl, 2-(Cyclobutanthion-2-yl)ethyl,
 2-(Cyclobutanthion-3-yl)ethyl,
 2-(Cyclopentanthion-2-yl)-ethyl,
 2-(Cyclopentanthion-3-yl)ethyl,
 2-(Cyclohexanthion-2-yl)ethyl, 2-(Cyclohexanthion-4-yl)ethyl,
 15 2-(Cycloheptanthion-2-yl)ethyl,
 2-(Cyclooctanthion-2-yl)ethyl, 3-(Cyclobutanon-2-yl)propyl,
 3-(Cyclobutanon-3-yl)propyl, 3-(Cyclopentanon-2-yl)propyl,
 3-(Cyclopentanon-3-yl)propyl, 3-(Cyclohexanon-2-yl)propyl,
 3-(Cyclohexanon-4-yl)propyl, 3-(Cycloheptanon-2-yl)propyl,
 20 3-(Cyclooctanon-2-yl)propyl, 3-(Cyclobutanthion-2-yl)propyl,
 3-(Cyclobutanthion-3-yl)propyl,
 3-(Cyclopentanthion-2-yl)propyl,
 3-(Cyclopentanthion-3-yl)-propyl,
 3-(Cyclohexanthion-2-yl)propyl,
 25 3-(Cyclohexanthion-4-yl)propyl,
 3-(Cycloheptanthion-2-yl)propyl,
 3-(Cyclooctanthion-2-yl)propyl, 4-(Cyclobutanon-2-yl)butyl,
 4-(Cyclobutanon-3-yl)butyl, 4-(Cyclopentanon-2-yl)butyl,
 4-(Cyclopentanon-3-yl)butyl, 4-(Cyclohexanon-2-yl)butyl,
 30 4-(Cyclohexanon-4-yl)butyl, 4-(Cycloheptanon-2-yl)butyl,
 4-(Cyclooctanon-2-yl)butyl, 4-(Cyclobutanthion-2-yl)butyl,
 4-(Cyclobutanthion-3-yl)butyl,
 4-(Cyclopentanthion-2-yl)butyl,
 4-(Cyclopentanthion-3-yl)butyl,
 35 4-(Cyclohexanthion-2-yl)-butyl,
 4-(Cyclohexanthion-4-yl)butyl, 4-(Cycloheptanthion-2-yl)butyl
 oder 4-(Cyclooctanthion-2-yl)butyl, vorzugsweise für
 Cyclopentanon-2-ylmethyl, Cyclohexanon-2-ylmethyl,
 2-(Cyclopentanon-2-yl)ethyl oder 2-(Cyclohexanon-2-yl)ethyl.

40

Unter 3- bis 7-gliedrigem Heterocyclyl sind sowohl gesättigte,
 partiell oder vollständig ungesättigte als auch aromatische
 Heterocyclen mit einem, zwei oder drei Heteroatomen zu verstehen,
 wobei die Heteroatome ausgewählt sind unter Stickstoffatomen,
 45 Sauerstoff- und Schwefelatomen. Gesättigtes 3- bis 7-gliedriges

24

Heterocyclyl kann auch ein Carbonyl- oder Thiocarbonyl-Ringglied enthalten.

Beispiele für gesättigte Heterocyclen, die ein Carbonyl- oder

- 5 Thiocarbonyl-Ringglied enthalten können, sind:
Oxiranyl, Thiranyl, Aziridin-1-yl, Aziridin-2-yl,
Diaziridin-1-yl, Diaziridin-3-yl, Oxetan-2-yl, Oxetan-3-yl,
Thietan-2-yl, Thietan-3-yl, Azetidin-1-yl, Azetidin-2-yl,
Azetidin-3-yl, Tetrahydrofuran-2-yl, Tetrahydrofuran-3-yl,
10 Tetrahydrothiophen-2-yl, Tetrahydrothiophen-3-yl,
Pyrrolidin-1-yl, Pyrrolidin-2-yl, Pyrrolidin-3-yl,
1,3-Dioxolan-2-yl, 1,3-Dioxolan-4-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl,
1,3-Oxathiolan-4-yl, 1,3-Oxathiolan-5-yl, 1,3-Oxazolidin-2-yl,
1,3-Oxazolidin-3-yl, 1,3-Oxazolidin-4-yl, 1,3-Oxazolidin-5-yl,
15 1,2-Oxazolidin-2-yl, 1,2-Oxazolidin-3-yl, 1,2-Oxazolidin-4-yl,
1,2-Oxazolidin-5-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl, 1,3-Dithiolan-4-yl,
Pyrrolidin-1-yl, Pyrrolidin-2-yl, Pyrrolidin-5-yl,
Tetrahydropyrazol-1-yl, Tetrahydropyrazol-3-yl,
Tetrahydropyrazol-4-yl, Tetrahydropyran-2-yl,
20 Tetrahydropyran-3-yl, Tetrahydropyran-4-yl,
Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothiopyran-3-yl,
Tetrahydropyran-4-yl, Piperidin-1-yl, Piperidin-2-yl,
Piperidin-3-yl, Piperidin-4-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Dioxan-4-yl,
1,3-Dioxan-5-yl, 1,4-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl,
25 1,3-Oxathian-4-yl, 1,3-Oxathian-5-yl, 1,3-Oxathian-6-yl,
1,4-Oxathian-2-yl, 1,4-Oxathian-3-yl, Morpholin-2-yl,
Morpholin-3-yl, Morpholin-4-yl, Hexahydropyridazin-1-yl,
Hexahydropyridazin-3-yl, Hexahydropyridazin-4-yl,
Hexahydropyrimidin-1-yl, Hexahydropyrimidin-2-yl,
30 Hexahydropyrimidin-4-yl, Hexahydropyrimidin-5-yl, Piperazin-1-yl,
Piperazin-2-yl, Piperazin-3-yl, Hexahydro-1,3,5-triazin-1-yl,
Hexahydro-1,3,5-triazin-2-yl, Oxepan-2-yl, Oxepan-3-yl,
Oxepan-4-yl, Thiepan-2-yl, Thiepan-3-yl, Thiepan-4-yl,
1,3-Dioxepan-2-yl, 1,3-Dioxepan-4-yl, 1,3-Dioxepan-5-yl,
35 1,3-Dioxepan-6-yl, 1,3-Dithiepan-2-yl, 1,3-Dithiepan-4-yl,
1,3-Dithiepan-5-yl, 1,3-Dithiepan-6-yl, 1,4-Dioxepan-2-yl,
1,4-Dioxepan-7-yl, Hexahydroazepin-1-yl, Hexahydroazepin-2-yl,
Hexahydroazepin-3-yl, Hexahydroazepin-4-yl,
Hexahydro-1,3-diazepin-1-yl, Hexahydro-1,3-diazepin-2-yl,
40 Hexahydro-1,3-diazepin-4-yl, Hexahydro-1,4-diazepin-1-yl und
Hexahydro-1,4-diazepin-2-yl.

Beispiele für ungesättigte Heterocyclen, die ein Carbonyl- oder Thiocarbonyl-Ringglied enthalten können, sind:

- 45 Dihydrofuran-2-yl, 1,2-Oxazolin-3-yl, 1,2-Oxazolin-5-yl,
1,3-Oxazolin-2-yl.

25

- Beispiele für aromatisches Heterocyclyl sind die 5- und 6-gliedrigen aromatischen, heterocyclischen Reste, z.B. Furyl wie 2-Furyl und 3-Furyl, Thienyl wie 2-Thienyl und 3-Thienyl, Pyrrolyl wie 2-Pyrrolyl und 3-Pyrrolyl, Isoxazolyl wie 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl und 5-Isoxazolyl, Isothiazolyl wie 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl und 5-Isothiazolyl, Pyrazolyl wie 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl und 5-Pyrazolyl, Oxazolyl wie 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl und 5-Oxazolyl, Thiazolyl wie 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl und 5-Thiazolyl, Imidazolyl wie 2-Imidazolyl und 4-Imidazolyl, Oxadiazolyl wie 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl und 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, Thiadiazolyl wie 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl und 1,3,4-Thiadiazol-2-yl, Triazolyl wie 1,2,4-Triazol-1-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl und 1,2,4-Triazol-4-yl, Pyridinyl wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl und 4-Pyridinyl, Pyridazinyl wie 3-Pyridazinyl und 4-Pyridazinyl, Pyrimidinyl wie 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl und 5-Pyrimidinyl, des weiteren 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl, insbesondere Pyridyl, Pyrimidyl, Furanyl und Thienyl.

20

- Beispiele für anellierte Ringe sind neben Phenyl die vorgenannten heteroaromatischen Gruppen, insbesondere Pyridin, Pyrazin, Pyridazin, Pyrimidin, Furan, Dihydrofuran, Thiophen, Dihydrothiophen, Pyrrol, Dihydropyrrol, 1,3-Dioxolan, 1,3-Dioxolan-2-on, Isoxazol, Oxazol, Oxazolinon, Isothiazol, Thiazol, Pyrazol, Pyrazolin, Imidazol, Imidazolinon, Dihydroimidazol, 1,2,3-Triazol, 1,1-Dioxodihydroisothiazol, Dihydro-1,4-dioxin, Pyridon, Dihydro-1,4-oxazin, Dihydro-1,4-oxazin-2-on, Dihydro-1,4-oxazin-3-on, Dihydro-1,3-oxazin, Dihydro-1,3-thiazin-2-on, Dihydro-1,4-thiazin, Dihydro-1,4-thiazin-2-on, Dihydro-1,4-thiazin-3-on, Dihydro-1,3-thiazin und Dihydro-1,3-thiazin-2-on, die ihrerseits einen, zwei oder drei Substituenten aufweisen können. Beispiele für geeignete Substituenten am anellierten Ring sind die im Folgenden für R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ und R¹⁹ angegebenen Bedeutungen.

- Im Hinblick auf die Verwendung der 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone I als Herbizide oder Desikkantien/Defoliantien sind diejenigen Verbindungen I bevorzugt, in denen die Variablen folgende Bedeutung haben, und zwar jeweils für sich alleine oder in Kombination:

R¹ Wasserstoff oder Halogen, insbesondere Chlor;

26

- R^2 , $R^{2'}$ unabhängig voneinander Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl, z.B. Methyl;
- R^3 C_1 - C_4 -Halogenalkyl, insbesondere C_1 - C_2 -Alkyl, das als Halogenatome Chlor und/oder Fluor trägt, besonders bevorzugt Trifluormethyl;
- R^4 Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor, oder Wasserstoff;
- R^5 Halogen, insbesondere Chlor, oder Cyano;
- A Sauerstoff;
- X eine chemische Bindung, Methylen, Ethan-1,2-diyl, Ethen-1,2-diyl, das unsubstituiert oder einen Substituenten, ausgewählt unter C_1 - C_4 -Alkyl, speziell Methyl, oder Halogen, speziell Chlor, aufweisen kann, z.B. 1- oder 2-Chlorethan-1,2-diyl, 1- oder 2-Chlorethen-1,2-diyl, 1- oder 2-Bromethan-1,2-diyl, 1- oder 2-Bromethen-1,2-diyl, 1- oder 2-Methylethan-1,2-diyl, 1- oder 2-Methylethen-1,2-diyl, insbesondere eine chemische Bindung, 1- oder 2-Chlorethan-1,2-diyl, 1- oder 2-Chlorethen-1,2-diyl, 1- oder 2-Bromethen-1,2-diyl, 1- oder 2-Methylethen-1,2-diyl. Wenn X für substituiertes Ethan-1,2-diyl, Ethen-1,2-diyl steht, sitzt der Substituent bevorzugt an dem der Gruppe R^6 benachbarten Kohlenstoffatom;
- R^6 Wasserstoff, Nitro, Halogen, Chlorsulfonyl, $-O-Y-R^8$, $-O-CO-Y-R^8$, $-N(Y-R^8)(Z-R^9)$, $-N(Y-R^8)-SO_2-Z-R^9$, $-N(SO_2-Y-R^8)(SO_2-Z-R^9)$, $-S(O)_n-Y-R^8$ mit $n = 0, 1$ oder 2 , $-SO_2-O-Y-R^8$, $-SO_2-N(Y-R^8)(Z-R^9)$, $-C(=NOR^{10})-Y-R^8$, $-C(=NOR^{10})-O-Y-R^8$, $-CO-Y-R^8$, $-CO-O-Y-R^8$, $-CO-S-Y-R^8$, $-PO(O-Y-R^8)$, $-CO-N(Y-R^8)(Z-R^9)$ oder $-CO-N(Y-R^8)(O-Z-R^9)$, insbesondere $-O-Y-R^8$, $-N(Y-R^8)-SO_2-Z-R^9$, $-SO_2-N(Y-R^8)(Z-R^9)$, $-C(=NOR^{10})-Y-R^8$, $-CO-O-Y-R^8$ oder $-CO-N(Y-R^8)(Z-R^9)$.

Die bei der Definition der Variablen R^6 genannten Variablen R^8 , R^9 , R^{10} , Y, Z haben vorzugsweise die folgenden Bedeutungen:

- Y, Z unabhängig voneinander eine chemische Bindung oder Methylen;
- R^8 , R^9 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_2 - C_6 -Halogenalkinyl, $-CH(R^{11})(R^{12})$, $-C(R^{11})(R^{12})-CN$, $-C(R^{11})(R^{12})$ -Halogen, $-C(R^{11})(R^{12})-OR^{13}$, $-C(R^{11})(R^{12})-N(R^{13})R^{14}$, $-C(R^{11})(R^{12})-N(R^{13})-OR^{14}$, $-C(R^{11})(R^{12})-SR^{13}$, $-C(R^{11})(R^{12})-SO-R^{13}$,

27

- $-C(R^{11})(R^{12})-SO_2-R^{13}$, $-C(R^{11})(R^{12})-SO_2-OR^{13}$,
 $-C(R^{11})(R^{12})-SO_2-N(R^{13})R^{14}$, $-C(R^{11})(R^{12})-CO-R^{13}$,
 $-C(R^{11})(R^{12})-C(=NOR^{15})-R^{13}$, $-C(R^{11})(R^{12})-CO-OR^{13}$,
 $-C(R^{11})(R^{12})-CO-SR^{13}$, $-C(R^{11})(R^{12})-CO-N(R^{13})R^{14}$,
5 $-C(R^{11})(R^{12})-CO-N(R^{13})-OR^{14}$, $-C(R^{11})(R^{12})-PO(OR^{13})_2$,
 C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl oder Phenyl,
das unsubstituiert sein oder ein, zwei, drei oder vier
Substituenten tragen kann, jeweils ausgewählt aus der Gruppe
bestehend aus Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Halogen,
10 C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Alkylsulfonyl,
 $(C_1-C_4$ -Alkyl)carbonyl und $(C_1-C_4$ -Alkoxy)carbonyl;

- insbesondere Wasserstoff, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alko-
xy- C_1-C_4 -alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Halogenalkenyl,
15 C_2-C_6 -Alkinyl, $-CH(R^{11})(R^{12})$, $-C(R^{11})(R^{12})-CO-OR^{13}$,
 $-C(R^{11})(R^{12})-CO-N(R^{13})R^{14}$, C_3-C_8 -Cycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl oder
 C_3-C_8 -Cycloalkyl, besonders bevorzugt Wasserstoff,
 C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl,
 C_2-C_6 -Alkinyl, $-C(R^{11})(R^{12})-CO-OR^{13}$ oder C_3-C_8 -Cycloalkyl;

- 20 worin die Variablen R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} und R^{15} unabhängig von-
einander bevorzugt die nachstehend angegebenen Bedeutungen
aufweisen:

- R^{11} , R^{12} unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1-C_4 -Alkyl,
25 C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -Alkylthio- C_1-C_4 -alkyl,
 $(C_1-C_4$ -Alkoxy)carbonyl- C_1-C_4 -alkyl oder
Phenyl- C_1-C_4 -alkyl, insbesondere Wasserstoff oder
 C_1-C_4 -Alkyl, speziell Methyl;

- R^{13} , R^{14} unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl,
30 C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl,
 C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Halogenalkenyl, C_2-C_6 -Alkinyl,
 C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl- C_1-C_4 -alkyl, Phenyl,
Phenyl- C_1-C_4 -alkyl, insbesondere Wasserstoff oder
 C_1-C_4 -Alkyl;

- 35 R^{15} C_1-C_6 -Alkyl; und

R^{10} Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy-carbonyl- C_1-C_4 -alkyl,
 C_2-C_6 -Alkenyl, insbesondere C_1-C_4 -Alkyl.

- 40 Verbindungen I, worin $Q = C-H$ ist und die Variablen X , R^4 , R^5 und
 R^6 die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen, werden im Folgenden
als Verbindungen IA bezeichnet. Verbindungen der Formel IA sind
erfindungsgemäß besonders bevorzugt. Verbindungen mit $Q = N$
werden im Folgenden als Verbindungen IB bezeichnet und sind eine
45 weitere erfindungsgemäße, bevorzugte Ausführungsform.

28

Wenn Q in Formel I für eine Gruppe C-R⁷ steht, dann können XR⁶ und R⁷ auch eine 3- oder 4-gliedrige Kette bilden, die neben Kohlenstoff 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter Stickstoff-, Sauerstoff- und Schwefelatomen, aufweisen kann. Diese Kette bildet mit dem Phenylring in Formel I einen annellierte Ring, der unsubstituiert sein oder seinerseits einen, zwei oder drei Substituenten tragen kann, und dessen Glieder auch ein oder zwei nicht benachbarte Carbonyl-, Thiocarbonyl- oder Sulfonyl-Gruppen umfassen können. Derartige Verbindungen werden im Folgenden als Verbindungen IC bezeichnet.

Unter den Verbindungen IC sind solche Verbindungen I bevorzugt, worin R⁷ zusammen mit X-R⁶ in Formel I für eine Kette der Formeln: -O-C(R¹⁶,R¹⁷)-CO-N(R¹⁸)-, -S-C(R¹⁶,R¹⁷)-CO-N(R¹⁸)- und besonders bevorzugt für -N=C(R¹⁹)-O- oder -N=C(R¹⁹)-S- stehen, in denen die Variablen R¹⁶ bis R¹⁹ die folgenden Bedeutungen haben:

R¹⁶, R¹⁷ unabhängig voneinander

Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl, insbesondere Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

R¹⁸ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Halogenalkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 3-, 4-, 5-, 6- oder 7-gliedriges, vorzugsweise 5- oder 6-gliedriges, vorzugsweise gesättigtes Heterocyclyl, das ein oder zwei, vorzugsweise ein Ring-Heteroatom, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, aufweist;

R¹⁹ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl,

29

- C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl,
 C₁-C₄-Halogenalkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkoxy,
 5 C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkylthio,
 Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl,
 Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkoxy,
 Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkylthio,
 10 C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 3-, 4-, 5-, 6- oder 7-gliedri-
 ges, vorzugsweise 5- oder 6-gliedriges, vorzugsweise gesät-
 tigtetes Heterocyclyl, das ein oder zwei, vorzugsweise ein
 Ring-Heteroatom, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff oder
 15 Schwefel, aufweist.

Vorzugsweise haben die Variablen R¹⁸ und R¹⁹ die folgenden Bedeu-
 tungen:

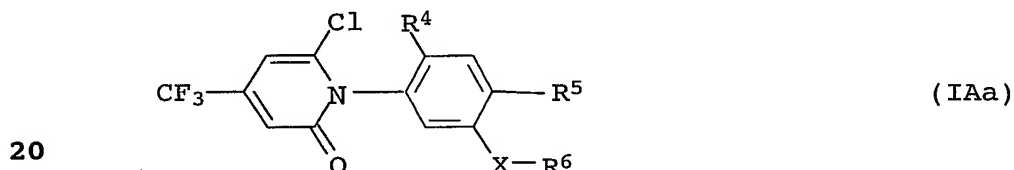
- 20 R¹⁸ Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₄-Alkoxy,
 C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy,
 C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cy-
 25 cloalkyl-C₁-C₄-alkyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl oder 3-, 4-, 5-
 oder 6-gliedriges, vorzugsweise 5- oder 6-gliedriges, vor-
 zugsweise gesättigtes Heterocyclyl, das ein Ring-Heteroatom,
 ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, auf-
 weist;
 30 R¹⁹ Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkynyl,
 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy,
 C₃-C₆-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino,
 35 C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkoxy,
 C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkylthio, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phe-
 nyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 3-, 4-,
 40 5- oder 6-gliedriges, vorzugsweise 5- oder 6-gliedriges, vor-
 zugsweise gesättigtes Heterocyclyl, das ein Ring-Heteroatom,
 ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, auf-
 weist.

30

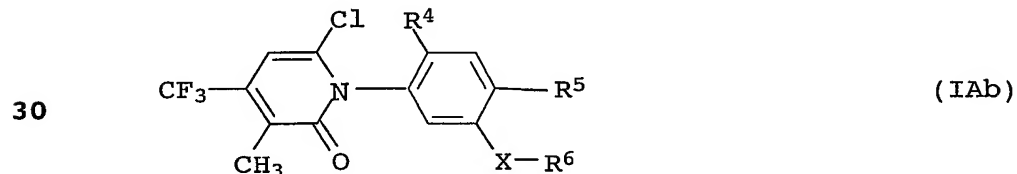
R⁴ und R⁵ haben in diesen Verbindungen IC unabhängig voneinander und insbesondere in Kombination die als bevorzugt angegebenen Bedeutungen.

5 Besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel IA mit R³ = CF₃ und R¹ = Cl, worin R² und R^{2'} unabhängig ausgewählt sind unter Wasserstoff und Methyl und in denen die Variablen X, R⁴, R⁵ und R⁶ die zuvor genannten Bedeutungen aufweisen und insbesondere ge-
 10 meinsam die in jeweils einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen.

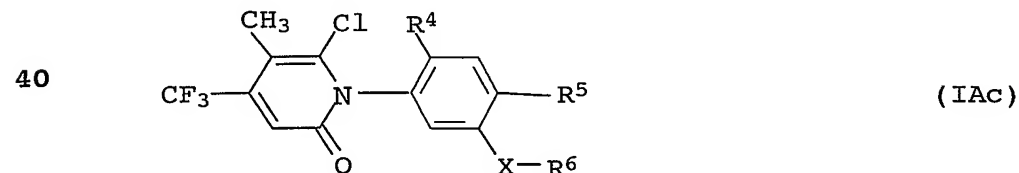
Beispiele für derartige Verbindungen sind die Verbindungen der nachfolgend angegebenen Formel IAa, worin R⁴, R⁵ und X-R⁶ gemein-
 15 sam die in jeweils einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen (Verbindungen IAa.1-IAa.798).



Beispiele für derartige Verbindungen sind auch die Verbindungen der nachfolgend angegebenen Formel IAb, worin R⁴, R⁵ und X-R⁶ ge-
 25 meinsam die in jeweils einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen (Verbindungen IAb.1-IAb.798)



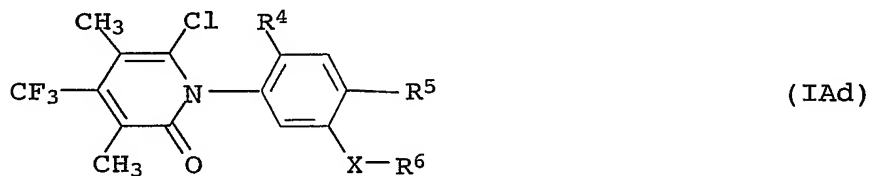
Beispiele für derartige Verbindungen sind auch die Verbindungen der nachfolgend angegebenen Formel IAc, worin R⁴, R⁵ und X-R⁶ ge-
 35 meinsam die in jeweils einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen (Verbindungen IAc.1-IAc.798).



31

Beispiele für derartige Verbindungen sind auch die Verbindungen der nachfolgend angegebenen Formel IAd, worin R⁴, R⁵ und X-R⁶ gemeinsam die in jeweils einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen (Verbindungen IAd.1-IAd.798).

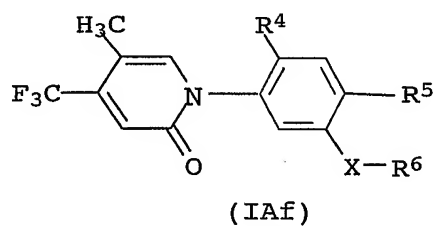
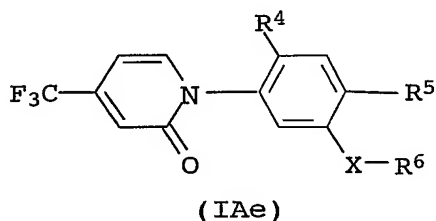
5



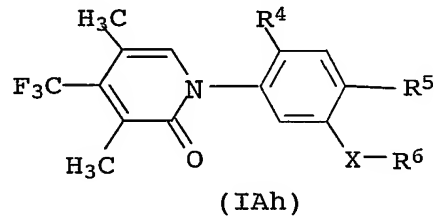
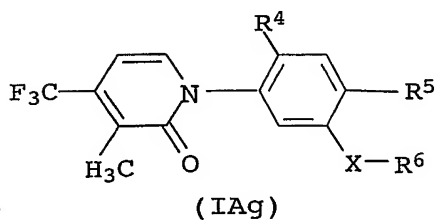
10

Beispiele für derartige Verbindungen sind auch die Verbindungen der nachfolgend angegebenen Formeln IAe, IAF, IAg und IAh, worin R⁴, R⁵ und X-R⁶ gemeinsam die in jeweils einer Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen (Verbindungen IAe.1-IAe.798, IAF.1-IAF.798, IAg.1-IAg.798 und IAh.1-IAh.798).

20



25



30

35

40

45

Tabelle 1

	Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	1	F	Cl	H
	2	F	Cl	F
	3	F	Cl	CH ₃
	4	F	Cl	NO ₂
	5	F	Cl	NH ₂
	6	F	Cl	OH
10	7	F	Cl	OCH ₃
	8	F	Cl	OCH(CH ₃) ₂
	9	F	Cl	O-CH ₂ CH=CH ₂
	10	F	Cl	O-CH ₂ C≡CH
	11	F	Cl	O-CH(CH ₃)C≡CH
15	12	F	Cl	O-Cyclopentyl
	13	F	Cl	OCH ₂ COOH
	14	F	Cl	OCH ₂ COO-CH ₃
	15	F	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	16	F	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	17	F	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
20	18	F	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	19	F	Cl	OCH ₂ CONH-CH ₃
	20	F	Cl	OCH ₂ CON(CH ₃) ₂
	21	F	Cl	OCH(CH ₃)COOH
	22	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₃
25	23	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	24	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	25	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	26	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	27	F	Cl	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃
	28	F	Cl	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
30	29	F	Cl	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	30	F	Cl	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	31	F	Cl	SH
	32	F	Cl	SCH ₃
35	33	F	Cl	SCH(CH ₃) ₂
	34	F	Cl	S-CH ₂ CH=CH ₂
	35	F	Cl	S-CH ₂ C≡CH
	36	F	Cl	S-CH(CH ₃)C≡CH
	37	F	Cl	S-Cyclopentyl
40	38	F	Cl	SCH ₂ COOH
	39	F	Cl	SCH ₂ COO-CH ₃
	40	F	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	41	F	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	42	F	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	43	F	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
45	44	F	Cl	SCH ₂ CONH-CH ₃
	45	F	Cl	SCH ₂ CON(CH ₃) ₂
	46	F	Cl	SCH(CH ₃)COOH
	47	F	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₃
	48	F	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃

33

Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	F	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	F	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	F	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	F	Cl	SCH(CH ₃)CONH-CH ₃
	F	Cl	SCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
10	F	Cl	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	F	Cl	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	F	Cl	COOH
	F	Cl	COOCH ₃
	F	Cl	COOCH ₂ CH ₃
15	F	Cl	COOCH(CH ₃) ₂
	F	Cl	COO-CH ₂ CH=CH ₂
	F	Cl	COO-CH ₂ C≡CH
	F	Cl	COO-Cyclopentyl
	F	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₃
20	F	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	F	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	F	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	F	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃
25	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	F	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
30	F	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	F	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	F	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	F	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	F	Cl	CONH ₂
35	F	Cl	CONHCH ₃
	F	Cl	CON(CH ₃) ₂
	F	Cl	CONH-CH ₂ COO-CH ₃
	F	Cl	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	F	Cl	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
40	F	Cl	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₃
	F	Cl	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	F	Cl	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	F	Cl	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₃
	F	Cl	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
45	F	Cl	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	F	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH ₃
	F	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COOCH ₃
	F	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COO-Phenyl
	F	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH(CH ₃)-COOCH ₃
	F	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₃
	F	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH ₃
	F	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	F	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₂ COOCH ₃
	F	Cl	CH=C(Cl)COO-CH(CH ₃)COOCH ₃
	F	Cl	CH=C(Cl)CON(CH ₃) ₂

34

Nr .	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
100	F	Cl	CH=C (Cl) CON (CH ₃) -CH ₂ COOCH ₃
101	F	Cl	CH=C (Cl) CONH-CH (CH ₃) COOCH ₃
102	F	Cl	CH=C (Br) COO-CH ₃
5 103	F	Cl	CH=C (Br) COO-CH ₂ CH ₃
104	F	Cl	CH=C (CH ₃) COO-CH ₃
105	F	Cl	CH=C (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₃
106	F	Cl	CH ₂ -CH (Cl) -COO-CH ₃
107	F	Cl	CH ₂ -CH (Cl) -COO-CH ₂ CH ₃
108	F	Cl	CHO
10 109	F	Cl	CH=N-OCH ₃
110	F	Cl	CH=N-OCH ₂ CH ₃
111	F	Cl	CH=N-OCH (CH ₃) COOCH ₃
112	F	Cl	SO ₂ Cl
113	F	Cl	SO ₂ NH ₂
15 114	F	Cl	SO ₂ NHCH ₃
115	F	Cl	SO ₂ N (CH ₃) ₂
116	F	Cl	NH-CH ₂ C≡CH
117	F	Cl	NHCH (CH ₃) COOCH ₃
118	F	Cl	N (CH ₃) -CH ₂ C≡CH
119	F	Cl	NH (SO ₂ CH ₃)
20 120	F	Cl	N (CH ₃) (SO ₂ CH ₃)
121	F	Cl	N (SO ₂ CH ₃) ₂
122	F	CN	H
123	F	CN	F
124	F	CN	CH ₃
25 125	F	CN	NO ₂
126	F	CN	NH ₂
127	F	CN	OH
128	F	CN	OCH ₃
129	F	CN	OCH (CH ₃) ₂
130	F	CN	O-CH ₂ CH=CH ₂
30 131	F	CN	O-CH ₂ C≡CH
132	F	CN	O-CH (CH ₃) C≡CH
133	F	CN	O-Cyclopentyl
134	F	CN	OCH ₂ COOH
135	F	CN	OCH ₂ COO-CH ₃
35 136	F	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
137	F	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
138	F	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
139	F	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
140	F	CN	OCH ₂ CONH-CH ₃
141	F	CN	OCH ₂ CON (CH ₃) ₂
40 142	F	CN	OCH (CH ₃) COOH
143	F	CN	OCH (CH ₃) COO-CH ₃
144	F	CN	OCH (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₃
145	F	CN	OCH (CH ₃) COO-CH ₂ CH=CH ₂
146	F	CN	OCH (CH ₃) COO-CH ₂ C≡CH
45 147	F	CN	OCH (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
148	F	CN	OCH (CH ₃) CONH-CH ₃
149	F	CN	OCH (CH ₃) CON (CH ₃) ₂
150	F	CN	OC (CH ₃) ₂ COO-CH ₃

35

Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
151	F	CN	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
152	F	CN	SH
153	F	CN	SCH ₃
5 154	F	CN	SCH(CH ₃) ₂
155	F	CN	S-CH ₂ CH=CH ₂
156	F	CN	S-CH ₂ C≡CH
157	F	CN	S-CH(CH ₃)C≡CH
158	F	CN	S-Cyclopentyl
159	F	CN	SCH ₂ COOH
10 160	F	CN	SCH ₂ COO-CH ₃
161	F	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
162	F	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
163	F	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
164	F	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
15 165	F	CN	SCH ₂ CONH-CH ₃
166	F	CN	SCH ₂ CON(CH ₃) ₂
167	F	CN	SCH(CH ₃)COOH
168	F	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₃
169	F	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
170	F	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
20 171	F	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
172	F	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
173	F	CN	SCH(CH ₃)CONH-CH ₃
174	F	CN	SCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
175	F	CN	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
25 176	F	CN	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
177	F	CN	COOH
178	F	CN	COOCH ₃
179	F	CN	COOCH ₂ CH ₃
180	F	CN	COOCH(CH ₃) ₂
181	F	CN	COO-CH ₂ CH=CH ₂
30 182	F	CN	COO-CH ₂ C≡CH
183	F	CN	COO-Cyclopentyl
184	F	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₃
185	F	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
186	F	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
187	F	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
35 188	F	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
189	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃
190	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
191	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
192	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
40 193	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
194	F	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
195	F	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₃
196	F	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
197	F	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ C≡CH
45 198	F	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
199	F	CN	CONH ₂
200	F	CN	CONHCH ₃
201	F	CN	CON(CH ₃) ₂

36

	Nr .	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	202	F	CN	CONH-CH ₂ COO-CH ₃
	203	F	CN	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	204	F	CN	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	205	F	CN	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₃
	206	F	CN	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
10	207	F	CN	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	208	F	CN	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₃
	209	F	CN	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	210	F	CN	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	211	F	CN	C(=N-OCH ₃)O-CH ₃
15	212	F	CN	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COOCH ₃
	213	F	CN	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COO-Phenyl
	214	F	CN	C(=N-OCH ₃)O-CH(CH ₃)-COOCH ₃
	215	F	CN	CH=C(Cl)COO-CH ₃
	216	F	CN	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH ₃
20	217	F	CN	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	218	F	CN	CH=C(Cl)COO-CH ₂ COOCH ₃
	219	F	CN	CH=C(Cl)COO-CH(CH ₃)COOCH ₃
	220	F	CN	CH=C(Cl)CON(CH ₃) ₂
	221	F	CN	CH=C(Cl)CON(CH ₃)-CH ₂ COOCH ₃
25	222	F	CN	CH=C(Cl)CONH-CH(CH ₃)COOCH ₃
	223	F	CN	CH=C(Br)COO-CH ₃
	224	F	CN	CH=C(Br)COO-CH ₂ CH ₃
	225	F	CN	CH=C(CH ₃)COO-CH ₃
	226	F	CN	CH=C(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
30	227	F	CN	CH ₂ -CH(Cl)-COO-CH ₃
	228	F	CN	CH ₂ -CH(Cl)-COO-CH ₂ CH ₃
	229	F	CN	CHO
	230	F	CN	CH=N-OCH ₃
	231	F	CN	CH=N-OCH ₂ CH ₃
35	232	F	CN	CH=N-OCH(CH ₃)COOCH ₃
	233	F	CN	SO ₂ Cl
	234	F	CN	SO ₂ NH ₂
	235	F	CN	SO ₂ NHCH ₃
	236	F	CN	SO ₂ N(CH ₃) ₂
40	237	F	CN	NH-CH ₂ C≡CH
	238	F	CN	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
	239	F	CN	N(CH ₃)-CH ₂ C≡CH
	240	F	CN	NH(SO ₂ CH ₃)
	241	F	CN	N(CH ₃)(SO ₂ CH ₃)
45	242	F	CN	N(SO ₂ CH ₃) ₂
	243	Cl	Cl	H
	244	Cl	Cl	F
	245	Cl	Cl	CH ₃
	246	Cl	Cl	NO ₂
	247	Cl	Cl	NH ₂
	248	Cl	Cl	OH
	249	Cl	Cl	OCH ₃
	250	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
	251	Cl	Cl	O-CH ₂ CH=CH ₂
	252	Cl	Cl	O-CH ₂ C≡CH

37

	Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	253	Cl	Cl	O-CH(CH ₃)C≡CH
	254	Cl	Cl	O-Cyclopentyl
	255	Cl	Cl	OCH ₂ COOH
	256	Cl	Cl	OCH ₂ COO-CH ₃
	257	Cl	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
10	258	Cl	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	259	Cl	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	260	Cl	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	261	Cl	Cl	OCH ₂ CONH-CH ₃
	262	Cl	Cl	OCH ₂ CON(CH ₃) ₂
15	263	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COOH
	264	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₃
	265	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	266	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	267	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
20	268	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	269	Cl	Cl	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃
	270	Cl	Cl	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
	271	Cl	Cl	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	272	Cl	Cl	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
25	273	Cl	Cl	SH
	274	Cl	Cl	SCH ₃
	275	Cl	Cl	SCH(CH ₃) ₂
	276	Cl	Cl	S-CH ₂ CH=CH ₂
	277	Cl	Cl	S-CH ₂ C≡CH
30	278	Cl	Cl	S-CH(CH ₃)C≡CH
	279	Cl	Cl	S-Cyclopentyl
	280	Cl	Cl	SCH ₂ COOH
	281	Cl	Cl	SCH ₂ COO-CH ₃
	282	Cl	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
35	283	Cl	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	284	Cl	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	285	Cl	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	286	Cl	Cl	SCH ₂ CONH-CH ₃
	287	Cl	Cl	SCH ₂ CON(CH ₃) ₂
40	288	Cl	Cl	SCH(CH ₃)COOH
	289	Cl	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₃
	290	Cl	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	291	Cl	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	292	Cl	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
45	293	Cl	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	294	Cl	Cl	SCH(CH ₃)CONH-CH ₃
	295	Cl	Cl	SCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
	296	Cl	Cl	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	297	Cl	Cl	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	298	Cl	Cl	COOH
	299	Cl	Cl	COOCH ₃
	300	Cl	Cl	COOCH ₂ CH ₃
	301	Cl	Cl	COOCH(CH ₃) ₂
	302	Cl	Cl	COO-CH ₂ CH=CH ₂
	303	Cl	Cl	COO-CH ₂ C≡CH

38

	Nr .	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	304	Cl	Cl	COO-Cyclopentyl
	305	Cl	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₃
	306	Cl	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	307	Cl	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	308	Cl	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
10	309	Cl	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	310	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃
	311	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	312	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	313	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
15	314	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	315	Cl	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	316	Cl	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	317	Cl	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	318	Cl	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ C≡CH
20	319	Cl	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	320	Cl	Cl	CONH ₂
	321	Cl	Cl	CONHCH ₃
	322	Cl	Cl	CON(CH ₃) ₂
	323	Cl	Cl	CONH-CH ₂ COO-CH ₃
25	324	Cl	Cl	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	325	Cl	Cl	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	326	Cl	Cl	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₃
	327	Cl	Cl	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	328	Cl	Cl	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
30	329	Cl	Cl	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₃
	330	Cl	Cl	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	331	Cl	Cl	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	332	Cl	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH ₃
	333	Cl	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COOCH ₃
35	334	Cl	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COO-Phenyl
	335	Cl	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH(CH ₃)-COOCH ₃
	336	Cl	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₃
	337	Cl	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH ₃
	338	Cl	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH=CH ₂
40	339	Cl	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₂ COOCH ₃
	340	Cl	Cl	CH=C(Cl)COO-CH(CH ₃)COOCH ₃
	341	Cl	Cl	CH=C(Cl)CON(CH ₃) ₂
	342	Cl	Cl	CH=C(Cl)CON(CH ₃)-CH ₂ COOCH ₃
	343	Cl	Cl	CH=C(Cl)CONH-CH(CH ₃)COOCH ₃
45	344	Cl	Cl	CH=C(Br)COO-CH ₃
	345	Cl	Cl	CH=C(Br)COO-CH ₂ CH ₃
	346	Cl	Cl	CH=C(CH ₃)COO-CH ₃
	347	Cl	Cl	CH=C(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	348	Cl	Cl	CH ₂ -CH(Cl)-COO-CH ₃
	349	Cl	Cl	CH ₂ -CH(Cl)-COO-CH ₂ CH ₃
	350	Cl	Cl	CHO
	351	Cl	Cl	CH=N-OCH ₃
	352	Cl	Cl	CH=N-OCH ₂ CH ₃
	353	Cl	Cl	CH=N-OCH(CH ₃)COOCH ₃
	354	Cl	Cl	SO ₂ Cl

39

	Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
	355	Cl	Cl	SO ₂ NH ₂
	356	Cl	Cl	SO ₂ NHCH ₃
	357	Cl	Cl	SO ₂ N(CH ₃) ₂
5	358	Cl	Cl	NH-CH ₂ C≡CH
	359	Cl	Cl	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
	360	Cl	Cl	N(CH ₃)-CH ₂ C≡CH
	361	Cl	Cl	NH(SO ₂ CH ₃)
	362	Cl	Cl	N(CH ₃)(SO ₂ CH ₃)
10	363	Cl	Cl	N(SO ₂ CH ₃) ₂
	364	Cl	CN	H
	365	Cl	CN	F
	366	Cl	CN	CH ₃
	367	Cl	CN	NO ₂
	368	Cl	CN	NH ₂
15	369	Cl	CN	OH
	370	Cl	CN	OCH ₃
	371	Cl	CN	OCH(CH ₃) ₂
	372	Cl	CN	O-CH ₂ CH=CH ₂
	373	Cl	CN	O-CH ₂ C≡CH
20	374	Cl	CN	O-CH(CH ₃)C≡CH
	375	Cl	CN	O-Cyclopentyl
	376	Cl	CN	OCH ₂ COOH
	377	Cl	CN	OCH ₂ COO-CH ₃
	378	Cl	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	379	Cl	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
25	380	Cl	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	381	Cl	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	382	Cl	CN	OCH ₂ CONH-CH ₃
	383	Cl	CN	OCH ₂ CON(CH ₃) ₂
	384	Cl	CN	OCH(CH ₃)COOH
	385	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₃
30	386	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	387	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	388	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	389	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	390	Cl	CN	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃
35	391	Cl	CN	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
	392	Cl	CN	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	393	Cl	CN	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	394	Cl	CN	SH
	395	Cl	CN	SCH ₃
	396	Cl	CN	SCH(CH ₃) ₂
40	397	Cl	CN	S-CH ₂ CH=CH ₂
	398	Cl	CN	S-CH ₂ C≡CH
	399	Cl	CN	S-CH(CH ₃)C≡CH
	400	Cl	CN	S-Cyclopentyl
	401	Cl	CN	SCH ₂ COOH
45	402	Cl	CN	SCH ₂ COO-CH ₃
	403	Cl	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	404	Cl	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	405	Cl	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH

40

	Nr .	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	406	Cl	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	407	Cl	CN	SCH ₂ CONH-CH ₃
	408	Cl	CN	SCH ₂ CON (CH ₃) ₂
	409	Cl	CN	SCH (CH ₃) COOH
	410	Cl	CN	SCH (CH ₃) COO-CH ₃
10	411	Cl	CN	SCH (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₃
	412	Cl	CN	SCH (CH ₃) COO-CH ₂ CH=CH ₂
	413	Cl	CN	SCH (CH ₃) COO-CH ₂ C≡CH
	414	Cl	CN	SCH (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	415	Cl	CN	SCH (CH ₃) CONH-CH ₃
15	416	Cl	CN	SCH (CH ₃) CON (CH ₃) ₂
	417	Cl	CN	SC (CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	418	Cl	CN	SC (CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	419	Cl	CN	COOH
	420	Cl	CN	COOCH ₃
20	421	Cl	CN	COOCH ₂ CH ₃
	422	Cl	CN	COOCH (CH ₃) ₂
	423	Cl	CN	COO-CH ₂ CH=CH ₂
	424	Cl	CN	COO-CH ₂ C≡CH
	425	Cl	CN	COO-Cyclopentyl
25	426	Cl	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₃
	427	Cl	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	428	Cl	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	429	Cl	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	430	Cl	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
30	431	Cl	CN	COO-CH (CH ₃) COO-CH ₃
	432	Cl	CN	COO-CH (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₃
	433	Cl	CN	COO-CH (CH ₃) COO-CH ₂ CH=CH ₂
	434	Cl	CN	COO-CH (CH ₃) COO-CH ₂ C≡CH
	435	Cl	CN	COO-CH (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
35	436	Cl	CN	COO-C (CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	437	Cl	CN	COO-C (CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	438	Cl	CN	COO-C (CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	439	Cl	CN	COO-C (CH ₃) ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	440	Cl	CN	COO-C (CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
40	441	Cl	CN	CONH ₂
	442	Cl	CN	CONHCH ₃
	443	Cl	CN	CON (CH ₃) ₂
	444	Cl	CN	CONH-CH ₂ COO-CH ₃
	445	Cl	CN	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
45	446	Cl	CN	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	447	Cl	CN	CONH-CH (CH ₃) COO-CH ₃
	448	Cl	CN	CONH-CH (CH ₃) COO-CH ₂ CH=CH ₂
	449	Cl	CN	CONH-CH (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	450	Cl	CN	CON (CH ₃) -CH ₂ COO-CH ₃
45	451	Cl	CN	CON (CH ₃) -CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	452	Cl	CN	CON (CH ₃) -CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	453	Cl	CN	C (=N-OCH ₃) O-CH ₃
	454	Cl	CN	C (=N-OCH ₃) O-CH ₂ -COOCH ₃
	455	Cl	CN	C (=N-OCH ₃) O-CH ₂ -COO-Phenyl
	456	Cl	CN	C (=N-OCH ₃) O-CH (CH ₃) -COOCH ₃

41

	Nr .	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	457	Cl	CN	CH=C (Cl) COO-CH ₃
	458	Cl	CN	CH=C (Cl) COO-CH ₂ CH ₃
	459	Cl	CN	CH=C (Cl) COO-CH ₂ CH=CH ₂
	460	Cl	CN	CH=C (Cl) COO-CH ₂ COOCH ₃
	461	Cl	CN	CH=C (Cl) COO-CH (CH ₃) COOCH ₃
	462	Cl	CN	CH=C (Cl) CON (CH ₃) ₂
	463	Cl	CN	CH=C (Cl) CON (CH ₃) -CH ₂ COOCH ₃
10	464	Cl	CN	CH=C (Cl) CONH-CH (CH ₃) COOCH ₃
	465	Cl	CN	CH=C (Br) COO-CH ₃
	466	Cl	CN	CH=C (Br) COO-CH ₂ CH ₃
	467	Cl	CN	CH=C (CH ₃) COO-CH ₃
	468	Cl	CN	CH=C (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₃
15	469	Cl	CN	CH ₂ -CH (Cl) -COO-CH ₃
	470	Cl	CN	CH ₂ -CH (Cl) -COO-CH ₂ CH ₃
	471	Cl	CN	CHO
	472	Cl	CN	CH=N-OCH ₃
	473	Cl	CN	CH=N-OCH ₂ CH ₃
	474	Cl	CN	CH=N-OCH (CH ₃) COOCH ₃
	475	Cl	CN	SO ₂ Cl
20	476	Cl	CN	SO ₂ NH ₂
	477	Cl	CN	SO ₂ NHCH ₃
	478	Cl	CN	SO ₂ N (CH ₃) ₂
	479	Cl	CN	NH-CH ₂ C≡CH
	480	Cl	CN	NHCH (CH ₃) COOCH ₃
25	481	Cl	CN	N (CH ₃) -CH ₂ C≡CH
	482	Cl	CN	NH (SO ₂ CH ₃)
	483	Cl	CN	N (CH ₃) (SO ₂ CH ₃)
	484	Cl	CN	N (SO ₂ CH ₃) ₂
	485	H	Cl	H
30	486	H	Cl	F
	487	H	Cl	CH ₃
	488	H	Cl	NO ₂
	489	H	Cl	NH ₂
	490	H	Cl	OH
35	491	H	Cl	OCH ₃
	492	H	Cl	OCH (CH ₃) ₂
	493	H	Cl	O-CH ₂ CH=CH ₂
	494	H	Cl	O-CH ₂ C≡CH
	495	H	Cl	O-CH (CH ₃) C≡CH
	496	H	Cl	O-Cyclopentyl
	497	H	Cl	OCH ₂ COOH
40	498	H	Cl	OCH ₂ COO-CH ₃
	499	H	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	500	H	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	501	H	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	502	H	Cl	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
45	503	H	Cl	OCH ₂ CONH-CH ₃
	504	H	Cl	OCH ₂ CON (CH ₃) ₂
	505	H	Cl	OCH (CH ₃) COOH
	506	H	Cl	OCH (CH ₃) COO-CH ₃
	507	H	Cl	OCH (CH ₃) COO-CH ₂ CH ₃

42

	Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	508	H	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	509	H	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	510	H	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	511	H	Cl	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃
	512	H	Cl	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
10	513	H	Cl	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	514	H	Cl	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	515	H	Cl	SH
	516	H	Cl	SCH ₃
	517	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
15	518	H	Cl	S-CH ₂ CH=CH ₂
	519	H	Cl	S-CH ₂ C≡CH
	520	H	Cl	S-CH(CH ₃)C≡CH
	521	H	Cl	S-Cyclopentyl
	522	H	Cl	SCH ₂ COOH
20	523	H	Cl	SCH ₂ COO-CH ₃
	524	H	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	525	H	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	526	H	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	527	H	Cl	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
25	528	H	Cl	SCH ₂ CONH-CH ₃
	529	H	Cl	SCH ₂ CON(CH ₃) ₂
	530	H	Cl	SCH(CH ₃)COOH
	531	H	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₃
	532	H	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
30	533	H	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	534	H	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	535	H	Cl	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	536	H	Cl	SCH(CH ₃)CONH-CH ₃
	537	H	Cl	SCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
35	538	H	Cl	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	539	H	Cl	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	540	H	Cl	COOH
	541	H	Cl	COOCH ₃
	542	H	Cl	COOCH ₂ CH ₃
40	543	H	Cl	COOCH(CH ₃) ₂
	544	H	Cl	COO-CH ₂ CH=CH ₂
	545	H	Cl	COO-CH ₂ C≡CH
	546	H	Cl	COO-Cyclopentyl
	547	H	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₃
45	548	H	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	549	H	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	550	H	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	551	H	Cl	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	552	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃
	553	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	554	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	555	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	556	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	557	H	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	558	H	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₃

43

	Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	559	H	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	560	H	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	561	H	Cl	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	562	H	Cl	CONH ₂
	563	H	Cl	CONHCH ₃
10	564	H	Cl	CON(CH ₃) ₂
	565	H	Cl	CONH-CH ₂ COO-CH ₃
	566	H	Cl	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	567	H	Cl	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	568	H	Cl	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₃
15	569	H	Cl	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	570	H	Cl	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	571	H	Cl	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₃
	572	H	Cl	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	573	H	Cl	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
20	574	H	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH ₃
	575	H	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COOCH ₃
	576	H	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COO-Phenyl
	577	H	Cl	C(=N-OCH ₃)O-CH(CH ₃)-COOCH ₃
	578	H	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₃
25	579	H	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH ₃
	580	H	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	581	H	Cl	CH=C(Cl)COO-CH ₂ COOCH ₃
	582	H	Cl	CH=C(Cl)COO-CH(CH ₃)COOCH ₃
	583	H	Cl	CH=C(Cl)CON(CH ₃) ₂
30	584	H	Cl	CH=C(Cl)CON(CH ₃)-CH ₂ COOCH ₃
	585	H	Cl	CH=C(Cl)CONH-CH(CH ₃)COOCH ₃
	586	H	Cl	CH=C(Br)COO-CH ₃
	587	H	Cl	CH=C(Br)COO-CH ₂ CH ₃
	588	H	Cl	CH=C(CH ₃)COO-CH ₃
35	589	H	Cl	CH=C(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	590	H	Cl	CH ₂ -CH(Cl)-COO-CH ₃
	591	H	Cl	CH ₂ -CH(Cl)-COO-CH ₂ CH ₃
	592	H	Cl	CHO
	593	H	Cl	CH=N-OCH ₃
40	594	H	Cl	CH=N-OCH ₂ CH ₃
	595	H	Cl	CH=N-OCH(CH ₃)COOCH ₃
	596	H	Cl	SO ₂ Cl
	597	H	Cl	SO ₂ NH ₂
	598	H	Cl	SO ₂ NHCH ₃
45	599	H	Cl	SO ₂ N(CH ₃) ₂
	600	H	Cl	NH-CH ₂ C≡CH
	601	H	Cl	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
	602	H	Cl	N(CH ₃)-CH ₂ C≡CH
	603	H	Cl	NH(SO ₂ CH ₃)
	604	H	Cl	N(CH ₃)(SO ₂ CH ₃)
	605	H	Cl	N(SO ₂ CH ₃) ₂
	606	H	CN	H
	607	H	CN	F
	608	H	CN	CH ₃
	609	H	CN	NO ₂

44

	Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
	610	H	CN	NH ₂
	611	H	CN	OH
	612	H	CN	OCH ₃
5	613	H	CN	OCH(CH ₃) ₂
	614	H	CN	O-CH ₂ CH=CH ₂
	615	H	CN	O-CH ₂ C≡CH
	616	H	CN	O-CH(CH ₃)C≡CH
	617	H	CN	O-Cyclopentyl
10	618	H	CN	OCH ₂ COOH
	619	H	CN	OCH ₂ COO-CH ₃
	620	H	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	621	H	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	622	H	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	623	H	CN	OCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
15	624	H	CN	OCH ₂ CONH-CH ₃
	625	H	CN	OCH ₂ CON(CH ₃) ₂
	626	H	CN	OCH(CH ₃)COOH
	627	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₃
	628	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
20	629	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	630	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	631	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	632	H	CN	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃
	633	H	CN	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
	634	H	CN	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
25	635	H	CN	OC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	636	H	CN	SH
	637	H	CN	SCH ₃
	638	H	CN	SCH(CH ₃) ₂
	639	H	CN	S-CH ₂ CH=CH ₂
	640	H	CN	S-CH ₂ C≡CH
30	641	H	CN	S-CH(CH ₃)C≡CH
	642	H	CN	S-Cyclopentyl
	643	H	CN	SCH ₂ COOH
	644	H	CN	SCH ₂ COO-CH ₃
	645	H	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
35	646	H	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	647	H	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	648	H	CN	SCH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	649	H	CN	SCH ₂ CONH-CH ₃
	650	H	CN	SCH ₂ CON(CH ₃) ₂
40	651	H	CN	SCH(CH ₃)COOH
	652	H	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₃
	653	H	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	654	H	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	655	H	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	656	H	CN	SCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
45	657	H	CN	SCH(CH ₃)CONH-CH ₃
	658	H	CN	SCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
	659	H	CN	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	660	H	CN	SC(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂

45

	Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	661	H	CN	COOH
	662	H	CN	COOCH ₃
	663	H	CN	COOCH ₂ CH ₃
	664	H	CN	COOCH(CH ₃) ₂
	665	H	CN	COO-CH ₂ CH=CH ₂
10	666	H	CN	COO-CH ₂ C≡CH
	667	H	CN	COO-Cyclopentyl
	668	H	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₃
	669	H	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	670	H	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
15	671	H	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	672	H	CN	COO-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	673	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃
	674	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	675	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
20	676	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH
	677	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	678	H	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₃
	679	H	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₃
	680	H	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
25	681	H	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ C≡CH
	682	H	CN	COO-C(CH ₃) ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	683	H	CN	CONH ₂
	684	H	CN	CONHCH ₃
	685	H	CN	CON(CH ₃) ₂
30	686	H	CN	CONH-CH ₂ COO-CH ₃
	687	H	CN	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	688	H	CN	CONH-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	689	H	CN	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₃
	690	H	CN	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂
35	691	H	CN	CONH-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	692	H	CN	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₃
	693	H	CN	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH=CH ₂
	694	H	CN	CON(CH ₃)-CH ₂ COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	695	H	CN	C(=N-OCH ₃)O-CH ₃
40	696	H	CN	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COOCH ₃
	697	H	CN	C(=N-OCH ₃)O-CH ₂ -COO-Phenyl
	698	H	CN	C(=N-OCH ₃)O-CH(CH ₃)-COOCH ₃
	699	H	CN	CH=C(Cl)COO-CH ₃
	700	H	CN	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH ₃
45	701	H	CN	CH=C(Cl)COO-CH ₂ CH=CH ₂
	702	H	CN	CH=C(Cl)COO-CH ₂ COOCH ₃
	703	H	CN	CH=C(Cl)COO-CH(CH ₃)COOCH ₃
	704	H	CN	CH=C(Cl)CON(CH ₃) ₂
	705	H	CN	CH=C(Cl)CON(CH ₃)-CH ₂ COOCH ₃
	706	H	CN	CH=C(Cl)CONH-CH(CH ₃)COOCH ₃
	707	H	CN	CH=C(Br)COO-CH ₃
	708	H	CN	CH=C(Br)COO-CH ₂ CH ₃
	709	H	CN	CH=C(CH ₃)COO-CH ₃
	710	H	CN	CH=C(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃
	711	H	CN	CH ₂ -CH(Cl)-COO-CH ₃

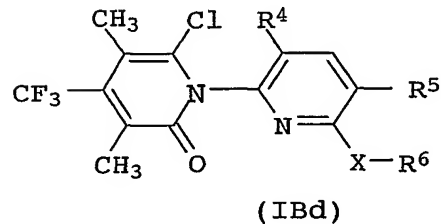
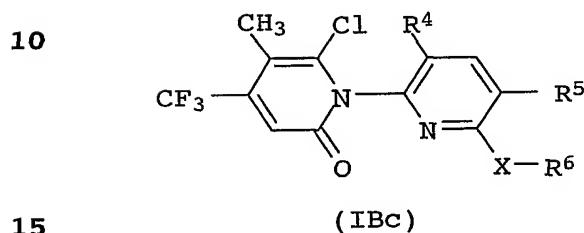
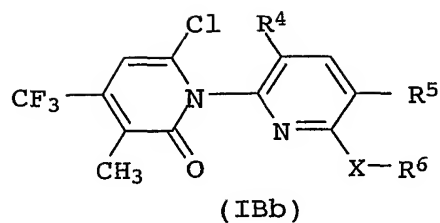
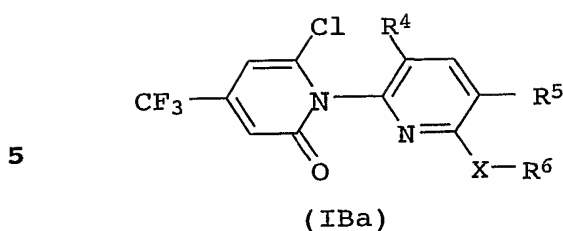
	Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶
5	712	H	CN	CH ₂ -CH(Cl)-COO-CH ₂ CH ₃
	713	H	CN	CHO
	714	H	CN	CH=N-OCH ₃
	715	H	CN	CH=N-OCH ₂ CH ₃
	716	H	CN	CH=N-OCH(CH ₃)COOCH ₃
10	717	H	CN	SO ₂ Cl
	718	H	CN	SO ₂ NH ₂
	719	H	CN	SO ₂ NHCH ₃
	720	H	CN	SO ₂ N(CH ₃) ₂
	721	H	CN	NH-CH ₂ C≡CH
15	722	H	CN	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
	723	H	CN	N(CH ₃)-CH ₂ C≡CH
	724	H	CN	NH(SO ₂ CH ₃)
	725	H	CN	N(CH ₃)(SO ₂ CH ₃)
	726	H	CN	N(SO ₂ CH ₃) ₂
20	727	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₃ (R-Enantiomer)
	728	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃ (R-Enantiomer)
	729	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂ (R-Enantiomer)
	730	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH (R-Enantiomer)
	731	F	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ (R-Enantiomer)
25	732	F	Cl	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃ (R-Enantiomer)
	733	F	Cl	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂ (R-Enantiomer)
	734	F	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₃ (R-Enantiomer)
	735	F	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃ (R-Enantiomer)
	736	F	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂ (R-Enantiomer)
30	737	F	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH (R-Enantiomer)
	738	F	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ (R-Enantiomer)
	739	F	CN	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃ (R-Enantiomer)
	740	F	CN	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂ (R-Enantiomer)
	741	H	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₃ (R-Enantiomer)
35	742	H	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃ (R-Enantiomer)
	743	H	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂ (R-Enantiomer)
	744	H	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH (R-Enantiomer)
	745	H	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ (R-Enantiomer)
	746	H	Cl	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃ (R-Enantiomer)
40	747	H	Cl	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂ (R-Enantiomer)
	748	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₃ (R-Enantiomer)
	749	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃ (R-Enantiomer)
	750	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂ (R-Enantiomer)
	751	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH (R-Enantiomer)
45	752	H	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ (R-Enantiomer)
	753	H	CN	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃ (R-Enantiomer)
	754	H	CN	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂ (R-Enantiomer)
	755	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₃ (R-Enantiomer)
	756	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃ (R-Enantiomer)
45	757	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂ (R-Enantiomer)
	758	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH (R-Enantiomer)
	759	Cl	Cl	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃ (R-Enantiomer)
	760	Cl	Cl	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃ (R-Enantiomer)
	761	Cl	Cl	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂ (R-Enantiomer)
	762	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₃ (R-Enantiomer)

47

	Nr.	R ⁴	R ⁵	X-R ⁶	
5	763	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃	(R-Enantiomer)
	764	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂	(R-Enantiomer)
	765	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH	(R-Enantiomer)
	766	Cl	CN	OCH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	(R-Enantiomer)
	767	Cl	CN	OCH(CH ₃)CONH-CH ₃	(R-Enantiomer)
10	768	Cl	CN	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂	(R-Enantiomer)
	769	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃	(S-Enantiomer)
	770	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃	(S-Enantiomer)
	771	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂	(S-Enantiomer)
	772	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH	(S-Enantiomer)
15	773	F	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	(S-Enantiomer)
	774	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃	(S-Enantiomer)
	775	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃	(S-Enantiomer)
	776	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂	(S-Enantiomer)
	777	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH	(S-Enantiomer)
20	778	F	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	(S-Enantiomer)
	779	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃	(S-Enantiomer)
	780	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃	(S-Enantiomer)
	781	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂	(S-Enantiomer)
	782	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH	(S-Enantiomer)
25	783	Cl	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	(S-Enantiomer)
	784	Cl	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃	(S-Enantiomer)
	785	Cl	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃	(S-Enantiomer)
	786	Cl	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂	(S-Enantiomer)
	787	Cl	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH	(S-Enantiomer)
30	788	Cl	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	(S-Enantiomer)
	789	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃	(S-Enantiomer)
	790	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃	(S-Enantiomer)
	791	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂	(S-Enantiomer)
	792	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH	(S-Enantiomer)
35	793	H	Cl	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	(S-Enantiomer)
	794	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₃	(S-Enantiomer)
	795	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₃	(S-Enantiomer)
	796	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH=CH ₂	(S-Enantiomer)
	797	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ C≡CH	(S-Enantiomer)
	798	H	CN	COO-CH(CH ₃)COO-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	(S-Enantiomer)

- 35 Unter den Verbindungen IB (Q = N) sind die Verbindungen mit R³ = CF₃ und R¹ = Cl bevorzugt, worin R² und R^{2'} unabhängig ausgewählt sind unter Wasserstoff und Methyl. Beispiele hierfür sind die Verbindungen der nachstehend angegebenen Formeln IBa, IBb, IBc und IBd, worin R⁴, R⁵ und X-R⁶ gemeinsam die in jeweils einer
- 40 Zeile der Tabelle 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen (Verbindungen IBa.1-IBa.798 bis IBd.1-IBd.798).

48



Unter den Verbindungen IC sind solche Verbindungen besonders bevorzugt, in denen R^7 zusammen mit $X-R^6$ für eine Kette der Formel $-N=C(R^{19})-O-$ oder $-N=C(R^{19})-S-$ steht, worin die Variable R^{19} die

20 zuvor angegebenen Bedeutungen, insbesondere die als bevorzugt angegebenen Bedeutungen aufweist. Diese Verbindungen werden im Folgenden auch als Benzoxazolyropyridone bzw. als Benzothiazolyropyridone bezeichnet. Hierbei werden solche Verbindungen bevorzugt, in denen das Chalkogenatom an Kohlenstoffatom gebunden ist, welches

25 der Verknüpfungsstelle zum Pyridonring benachbart ist.

Unter diesen Verbindungen sind wiederum solche Verbindungen mit $R^3 = CF_3$ und $R^1 = Cl$ bevorzugt, worin R^2 und $R^{2'}$ unabhängig ausgewählt sind unter Wasserstoff und Methyl.

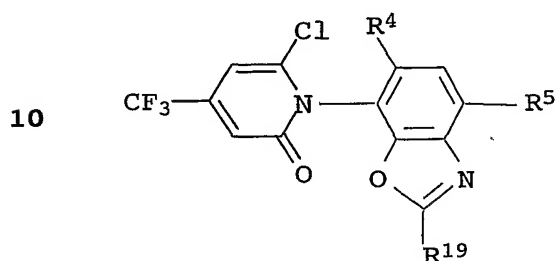
30

35

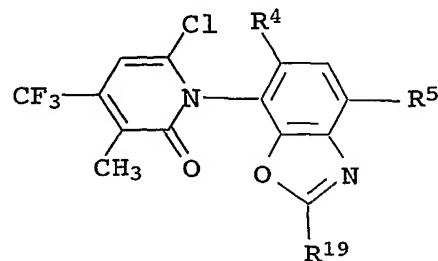
40

45

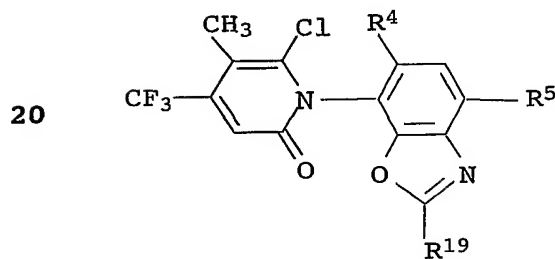
Beispiele hierfür sind die 1-Benzoxazol-7-yl-1H-2-pyridone der nachstehend angegebenen Formeln ICa, ICb, ICc und ICd, worin R⁴, R⁵ und R¹⁹ gemeinsam die in jeweils einer Zeile der Tabelle 2 angegebenen Bedeutungen aufweisen (Verbindungen ICa.1-ICa.312 bis ICd.1-ICd.312).



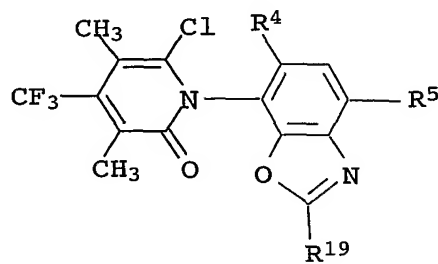
(ICa)



(ICb)



(ICc)



(ICd)

Tabelle 2

Nr.	R ⁴	R ⁵	R ¹⁹
30	1	F	Cl
2	F	Cl	H
3	F	Cl	CH ₃
4	F	Cl	C ₂ H ₅
5	F	Cl	n-C ₃ H ₇
6	F	Cl	CH(CH ₃) ₂
35	7	F	Cl
8	F	Cl	n-C ₄ H ₉
9	F	Cl	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
10	F	Cl	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
11	F	Cl	C(CH ₃) ₃
12	F	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
40	13	F	Cl
14	F	Cl	CH ₂ -C≡CH
15	F	Cl	CH ₂ Cl
16	F	Cl	CF ₃
17	F	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
18	F	Cl	Cyclopropyl
45	19	F	Cl
20	F	Cl	Cyclopentyl
	F	Cl	Cyclohexyl
	F	Cl	Tetrahydropyran-3-yl
	F	Cl	Tetrahydropyran-4-yl
	F	Cl	Tetrahydrothiopyran-3-yl

50

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ¹⁹
	21	F	Cl	Tetrahydrothiopyran-4-yl
	22	F	Cl	Phenyl
	23	F	Cl	CH ₂ -COOCH ₃
5	24	F	Cl	CH ₂ -COOC ₂ H ₅
	25	F	Cl	CH ₂ -CH ₂ -COOCH ₃
	26	F	Cl	CH ₂ -CH ₂ -COOC ₂ H ₅
	27	F	Cl	F
	28	F	Cl	Cl
	29	F	Cl	Br
10	30	F	Cl	OCH ₃
	31	F	Cl	OCH ₂ CH ₃
	32	F	Cl	O-n-C ₃ H ₇
	33	F	Cl	OCH(CH ₃) ₂
	34	F	Cl	OCH ₂ -CH=CH ₂
15	35	F	Cl	OCH ₂ -C≡CH
	36	F	Cl	OCH ₂ -COOCH ₃
	37	F	Cl	OCH ₂ -COOC ₂ H ₅
	38	F	Cl	OCH(CH ₃)-COOCH ₃
	39	F	Cl	OCH(CH ₃)-COOC ₂ H ₅
	40	F	Cl	NH ₂
20	41	F	Cl	N(CH ₃) ₂
	42	F	Cl	SCH ₃
	43	F	Cl	SCH ₂ CH ₃
	44	F	Cl	S-n-C ₃ H ₇
	45	F	Cl	SCH(CH ₃) ₂
25	46	F	Cl	SCH ₂ -CH=CH ₂
	47	F	Cl	SCH ₂ -C≡CH
	48	F	Cl	SCH ₂ -COOCH ₃
	49	F	Cl	SCH ₂ -COOC ₂ H ₅
	50	F	Cl	SCH(CH ₃)-COOCH ₃
	51	F	Cl	COOCH ₃
30	52	F	Cl	COOC ₂ H ₅
	53	Cl	Cl	H
	54	Cl	Cl	CH ₃
	55	Cl	Cl	C ₂ H ₅
	56	Cl	Cl	n-C ₃ H ₇
35	57	Cl	Cl	CH(CH ₃) ₂
	58	Cl	Cl	n-C ₄ H ₉
	59	Cl	Cl	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
	60	Cl	Cl	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
	61	Cl	Cl	C(CH ₃) ₃
	62	Cl	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
40	63	Cl	Cl	CH ₂ -C≡CH
	64	Cl	Cl	CH ₂ Cl
	65	Cl	Cl	CF ₃
	66	Cl	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
	67	Cl	Cl	Cyclopropyl
45	68	Cl	Cl	Cyclopentyl
	69	Cl	Cl	Cyclohexyl
	70	Cl	Cl	Tetrahydropyran-3-yl
	71	Cl	Cl	Tetrahydropyran-4-yl

51

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ¹⁹
	72	Cl	Cl	Tetrahydrothiopyran-3-yl
	73	Cl	Cl	Tetrahydrothiopyran-4-yl
	74	Cl	Cl	Phenyl
5	75	Cl	Cl	CH ₂ -COOCH ₃
	76	Cl	Cl	CH ₂ -COOC ₂ H ₅
	77	Cl	Cl	CH ₂ -CH ₂ -COOCH ₃
	78	Cl	Cl	CH ₂ -CH ₂ -COOC ₂ H ₅
	79	Cl	Cl	F
	80	Cl	Cl	Cl
10	81	Cl	Cl	Br
	82	Cl	Cl	OCH ₃
	83	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
	84	Cl	Cl	O-n-C ₃ H ₇
	85	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
15	86	Cl	Cl	OCH ₂ -CH=CH ₂
	87	Cl	Cl	OCH ₂ -C≡CH
	88	Cl	Cl	OCH ₂ -COOCH ₃
	89	Cl	Cl	OCH ₂ -COOC ₂ H ₅
	90	Cl	Cl	OCH(CH ₃)-COOCH ₃
	91	Cl	Cl	OCH(CH ₃)-COOC ₂ H ₅
20	92	Cl	Cl	NH ₂
	93	Cl	Cl	N(CH ₃) ₂
	94	Cl	Cl	SCH ₃
	95	Cl	Cl	SCH ₂ CH ₃
	96	Cl	Cl	S-n-C ₃ H ₇
25	97	Cl	Cl	SCH(CH ₃) ₂
	98	Cl	Cl	SCH ₂ -CH=CH ₂
	99	Cl	Cl	SCH ₂ -C≡CH
	100	Cl	Cl	SCH ₂ -COOCH ₃
	101	Cl	Cl	SCH ₂ -COOC ₂ H ₅
	102	Cl	Cl	SCH(CH ₃)-COOCH ₃
30	103	Cl	Cl	COOCH ₃
	104	Cl	Cl	COOC ₂ H ₅
	105	H	Cl	H
	106	H	Cl	CH ₃
	107	H	Cl	C ₂ H ₅
35	108	H	Cl	n-C ₃ H ₇
	109	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
	110	H	Cl	n-C ₄ H ₉
	111	H	Cl	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
	112	H	Cl	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
	113	H	Cl	C(CH ₃) ₃
40	114	H	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
	115	H	Cl	CH ₂ -C≡CH
	116	H	Cl	CH ₂ Cl
	117	H	Cl	CF ₃
	118	H	Cl	CH ₂ -Cyclopropyl
45	119	H	Cl	Cyclopropyl
	120	H	Cl	Cyclopentyl
	121	H	Cl	Cyclohexyl
	122	H	Cl	Tetrahydropyran-3-yl

52

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ¹⁹
	123	H	Cl	Tetrahydropyran-4-yl
	124	H	Cl	Tetrahydrothiopyran-3-yl
	125	H	Cl	Tetrahydrothiopyran-4-yl
5	126	H	Cl	Phenyl
	127	H	Cl	CH ₂ -COOCH ₃
	128	H	Cl	CH ₂ -COOC ₂ H ₅
	129	H	Cl	CH ₂ -CH ₂ -COOCH ₃
	130	H	Cl	CH ₂ -CH ₂ -COOC ₂ H ₅
10	131	H	Cl	F
	132	H	Cl	Cl
	133	H	Cl	Br
	134	H	Cl	OCH ₃
	135	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
	136	H	Cl	O-n-C ₃ H ₇
15	137	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂
	138	H	Cl	OCH ₂ -CH=CH ₂
	139	H	Cl	OCH ₂ -C≡CH
	140	H	Cl	OCH ₂ -COOCH ₃
	141	H	Cl	OCH ₂ -COOC ₂ H ₅
	142	H	Cl	OCH(CH ₃)-COOCH ₃
20	143	H	Cl	OCH(CH ₃)-COOC ₂ H ₅
	144	H	Cl	NH ₂
	145	H	Cl	N(CH ₃) ₂
	146	H	Cl	SCH ₃
	147	H	Cl	SCH ₂ CH ₃
25	148	H	Cl	S-n-C ₃ H ₇
	149	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
	150	H	Cl	SCH ₂ -CH=CH ₂
	151	H	Cl	SCH ₂ -C≡CH
	152	H	Cl	SCH ₂ -COOCH ₃
	153	H	Cl	SCH ₂ -COOC ₂ H ₅
30	154	H	Cl	SCH(CH ₃)-COOCH ₃
	155	H	Cl	COOCH ₃
	156	H	Cl	COOC ₂ H ₅
	157	F	CN	H
	158	F	CN	CH ₃
35	159	F	CN	C ₂ H ₅
	160	F	CN	n-C ₃ H ₇
	161	F	CN	CH(CH ₃) ₂
	162	F	CN	n-C ₄ H ₉
	163	F	CN	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
	164	F	CN	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
40	165	F	CN	C(CH ₃) ₃
	166	F	CN	CH ₂ -CH=CH ₂
	167	F	CN	CH ₂ -C≡CH
	168	F	CN	CH ₂ Cl
	169	F	CN	CF ₃
45	170	F	CN	CH ₂ -Cyclopropyl
	171	F	CN	Cyclopropyl
	172	F	CN	Cyclopentyl
	173	F	CN	Cyclohexyl

53

	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ¹⁹
5	174	F	CN	Tetrahydropyran-3-yl
	175	F	CN	Tetrahydropyran-4-yl
	176	F	CN	Tetrahydrothiopyran-3-yl
	177	F	CN	Tetrahydrothiopyran-4-yl
	178	F	CN	Phenyl
10	179	F	CN	CH ₂ -COOCH ₃
	180	F	CN	CH ₂ -COOC ₂ H ₅
	181	F	CN	CH ₂ -CH ₂ -COOCH ₃
	182	F	CN	CH ₂ -CH ₂ -COOC ₂ H ₅
	183	F	CN	F
15	184	F	CN	Cl
	185	F	CN	Br
	186	F	CN	OCH ₃
	187	F	CN	OCH ₂ CH ₃
	188	F	CN	O-n-C ₃ H ₇
20	189	F	CN	OCH(CH ₃) ₂
	190	F	CN	OCH ₂ -CH=CH ₂
	191	F	CN	OCH ₂ -C≡CH
	192	F	CN	OCH ₂ -COOCH ₃
	193	F	CN	OCH ₂ -COOC ₂ H ₅
25	194	F	CN	OCH(CH ₃)-COOCH ₃
	195	F	CN	OCH(CH ₃)-COOC ₂ H ₅
	196	F	CN	NH ₂
	197	F	CN	N(CH ₃) ₂
	198	F	CN	SCH ₃
30	199	F	CN	SCH ₂ CH ₃
	200	F	CN	S-n-C ₃ H ₇
	201	F	CN	SCH(CH ₃) ₂
	202	F	CN	SCH ₂ -CH=CH ₂
	203	F	CN	SCH ₂ -C≡CH
35	204	F	CN	SCH ₂ -COOCH ₃
	205	F	CN	SCH ₂ -COOC ₂ H ₅
	206	F	CN	SCH(CH ₃)-COOCH ₃
	207	F	CN	COOCH ₃
	208	F	CN	COOC ₂ H ₅
40	209	Cl	CN	H
	210	Cl	CN	CH ₃
	211	Cl	CN	C ₂ H ₅
	212	Cl	CN	n-C ₃ H ₇
	213	Cl	CN	CH(CH ₃) ₂
45	214	Cl	CN	n-C ₄ H ₉
	215	Cl	CN	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
	216	Cl	CN	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
	217	Cl	CN	C(CH ₃) ₃
	218	Cl	CN	CH ₂ -CH=CH ₂
	219	Cl	CN	CH ₂ -C≡CH
	220	Cl	CN	CH ₂ Cl
	221	Cl	CN	CF ₃
	222	Cl	CN	CH ₂ -Cyclopropyl
	223	Cl	CN	Cyclopropyl
	224	Cl	CN	Cyclopentyl

54

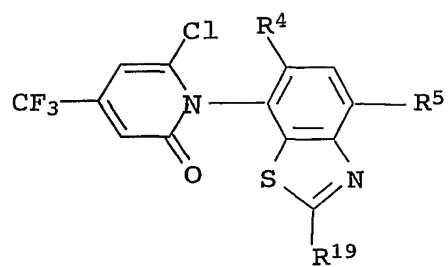
	Nr.	R ⁴	R ⁵	R ¹⁹
5	225	Cl	CN	Cyclohexyl
	226	Cl	CN	Tetrahydropyran-3-yl
	227	Cl	CN	Tetrahydropyran-4-yl
	228	Cl	CN	Tetrahydrothiopyran-3-yl
	229	Cl	CN	Tetrahydrothiopyran-4-yl
10	230	Cl	CN	Phenyl
	231	Cl	CN	CH ₂ -COOCH ₃
	232	Cl	CN	CH ₂ -COOC ₂ H ₅
	233	Cl	CN	CH ₂ -CH ₂ -COOCH ₃
	234	Cl	CN	CH ₂ -CH ₂ -COOC ₂ H ₅
15	235	Cl	CN	F
	236	Cl	CN	Cl
	237	Cl	CN	Br
	238	Cl	CN	OCH ₃
	239	Cl	CN	OCH ₂ CH ₃
20	240	Cl	CN	O-n-C ₃ H ₇
	241	Cl	CN	OCH(CH ₃) ₂
	242	Cl	CN	OCH ₂ -CH=CH ₂
	243	Cl	CN	OCH ₂ -C≡CH
	244	Cl	CN	OCH ₂ -COOCH ₃
25	245	Cl	CN	OCH ₂ -COOC ₂ H ₅
	246	Cl	CN	OCH(CH ₃)-COOCH ₃
	247	Cl	CN	OCH(CH ₃)-COOC ₂ H ₅
	248	Cl	CN	NH ₂
	249	Cl	CN	N(CH ₃) ₂
30	250	Cl	CN	SCH ₃
	251	Cl	CN	SCH ₂ CH ₃
	252	Cl	CN	S-n-C ₃ H ₇
	253	Cl	CN	SCH(CH ₃) ₂
	254	Cl	CN	SCH ₂ -CH=CH ₂
35	255	Cl	CN	SCH ₂ -C≡CH
	256	Cl	CN	SCH ₂ -COOCH ₃
	257	Cl	CN	SCH ₂ -COOC ₂ H ₅
	258	Cl	CN	SCH(CH ₃)-COOCH ₃
	259	Cl	CN	COOCH ₃
40	260	Cl	CN	COOC ₂ H ₅
	261	H	CN	H
	262	H	CN	CH ₃
	263	H	CN	C ₂ H ₅
	264	H	CN	n-C ₃ H ₇
45	265	H	CN	CH(CH ₃) ₂
	266	H	CN	n-C ₄ H ₉
	267	H	CN	CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
	268	H	CN	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
	269	H	CN	C(CH ₃) ₃
	270	H	CN	CH ₂ -CH=CH ₂
	271	H	CN	CH ₂ -C≡CH
	272	H	CN	CH ₂ Cl
	273	H	CN	CF ₃
	274	H	CN	CH ₂ -Cyclopropyl
	275	H	CN	Cyclopropyl

55

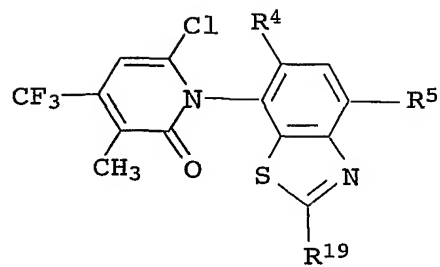
Nr.	R ⁴	R ⁵	R ¹⁹
276	H	CN	Cyclopentyl
277	H	CN	Cyclohexyl
278	H	CN	Tetrahydropyran-3-yl
279	H	CN	Tetrahydropyran-4-yl
280	H	CN	Tetrahydrothiopyran-3-yl
281	H	CN	Tetrahydrothiopyran-4-yl
282	H	CN	Phenyl
283	H	CN	CH ₂ -COOCH ₃
284	H	CN	CH ₂ -COOC ₂ H ₅
285	H	CN	CH ₂ -CH ₂ -COOCH ₃
286	H	CN	CH ₂ -CH ₂ -COOC ₂ H ₅
287	H	CN	F
288	H	CN	Cl
289	H	CN	Br
290	H	CN	OCH ₃
291	H	CN	OCH ₂ CH ₃
292	H	CN	O-n-C ₃ H ₇
293	H	CN	OCH(CH ₃) ₂
294	H	CN	OCH ₂ -CH=CH ₂
295	H	CN	OCH ₂ -C≡CH
296	H	CN	OCH ₂ -COOCH ₃
297	H	CN	OCH ₂ -COOC ₂ H ₅
298	H	CN	OCH(CH ₃)-COOCH ₃
299	H	CN	OCH(CH ₃)-COOC ₂ H ₅
300	H	CN	NH ₂
301	H	CN	N(CH ₃) ₂
302	H	CN	SCH ₃
303	H	CN	SCH ₂ CH ₃
304	H	CN	S-n-C ₃ H ₇
305	H	CN	SCH(CH ₃) ₂
306	H	CN	SCH ₂ -CH=CH ₂
307	H	CN	SCH ₂ -C≡CH
308	H	CN	SCH ₂ -COOCH ₃
309	H	CN	SCH ₂ -COOC ₂ H ₅
310	H	CN	SCH(CH ₃)-COOCH ₃
311	H	CN	COOCH ₃
312	H	CN	COOC ₂ H ₅

Beispiele für besonders bevorzugte Verbindungen IC sind auch die 1-Benzthiazol-7-yl-2-[1H]-pyridone der nachstehend angegebenen Formeln ICe, ICf, ICg und ICh, worin R⁴, R⁵ und R¹⁹ gemeinsam die in jeweils einer Zeile der Tabelle 2 angegebenen Bedeutungen aufweisen (Verbindungen ICe.1-ICe.312 bis ICh.1-ICh.312).

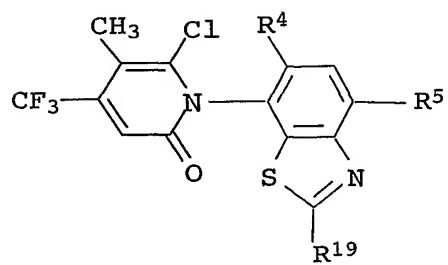
56



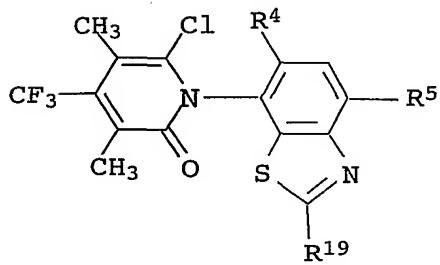
(ICE)



(ICf)

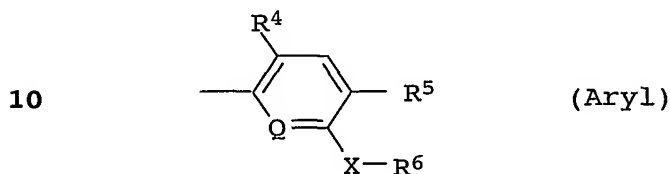


(ICg)

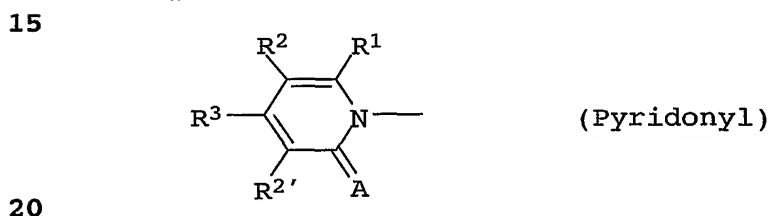


(ICh)

Die erfindungsgemäßen 1-Arylpyridone der Formel I können in Anlehnung an bekannte Verfahren zur Herstellung von 1-Arylpyridonen und insbesondere auf den nachstehend beschriebenen Synthesewegen hergestellt werden. Im Folgenden bedeutet "Aryl" einen Rest der Formel:



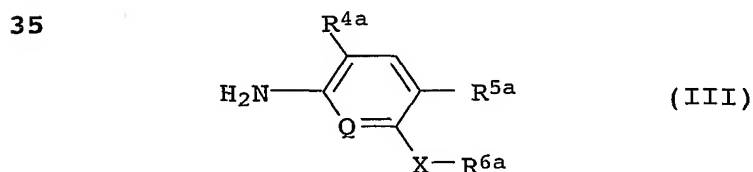
und "Pyridonyl" einen Rest der Formel:



A) Verknüpfung der Pyridoneinheit mit einer von dem Rest "Aryl" abgeleiteten aromatischen Verbindung.

25 A.1 Kondensation von 1,5-Dicarbonsäuren mit Arylaminen:

Die Herstellung von 1-Aryl-2[1H]-pyridonen der Formel I gelingt beispielsweise nach der in Schema 1 dargestellten Syntheseroute. Hierbei führt man in einem ersten Schritt eine Kondensation einer 3-Halogenalkyl-1,5-dicarbonsäure oder ihrem Anhydrid mit einem Arylamin der allgemeinen Formel III durch,



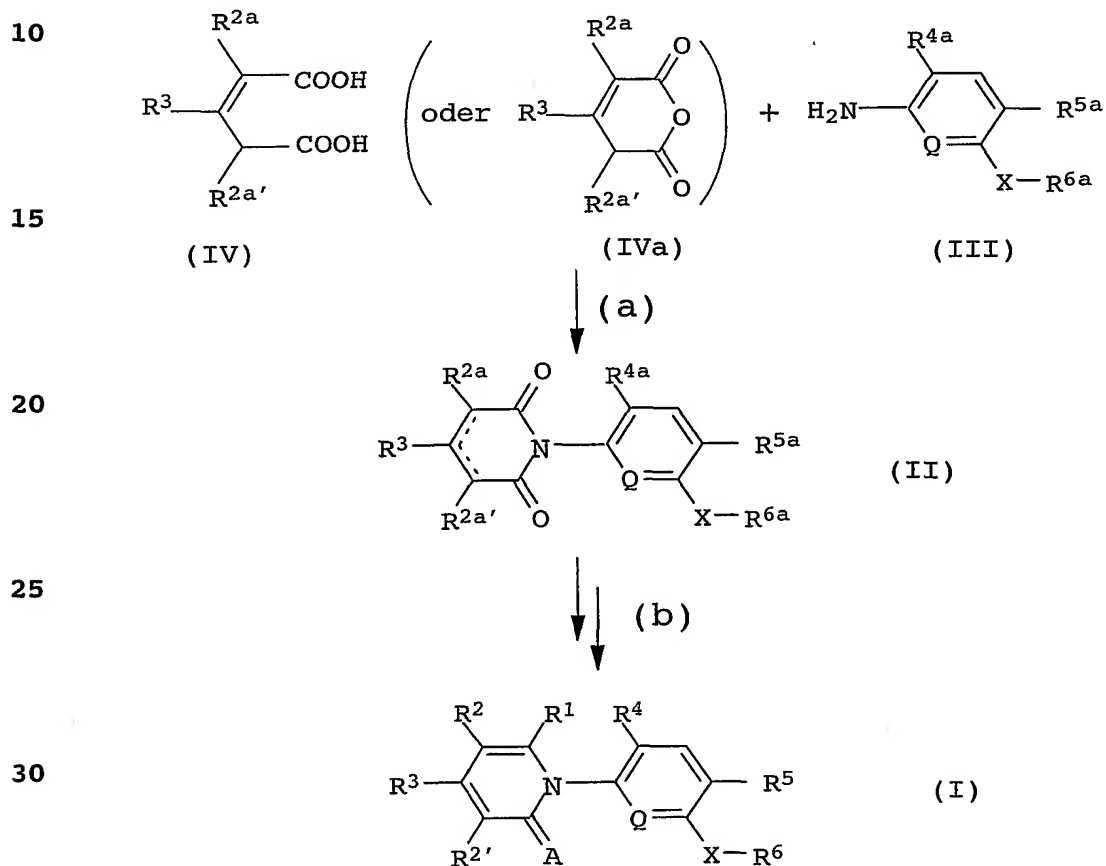
worin Q und X die zuvor angegebenen Bedeutungen aufweisen und R^{4a}, R^{5a} sowie R^{6a} für die zuvor definierten Reste R⁴, R⁵ und R⁶ stehen oder Substituenten bedeuten, die nach bekannten Verfahren (siehe z.B. die Ausführungen unter B und C) in die Reste R⁴, R⁵ und R⁶ umgewandelt werden können.

45

58

Die dabei erhaltenen cyclischen Imide der Formel II können anschließend nach bekannten Verfahren in die 1-Aryl-2[1H]-pyridone der Formel I umgewandelt werden. Diese Reaktionssequenz ist beispielhaft für die Umsetzung von III mit der 1,5-Dicarbonsäure IV (bzw. ihrem inneren Anhydrid) in Schema 1 dargestellt:

Schema 1:



In Schema 1 haben die Variablen Q, A, X, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^{4a} , R^{5a} sowie R^{6a} die zuvor genannten Bedeutungen. R^{2a} und $R^{2a'}$ haben die für R^2 bzw. $R^{2'}$ genannten, von Amino verschiedenen Bedeutungen oder stehen für Substituenten, die nach bekannten Verfahren (siehe z.B. die Ausführungen unter B) in die Reste R^2 bzw. $R^{2'}$ umgewandelt werden können. In Formel II bedeutet ---- jeweils eine Doppel- und eine Einfachbindung. Schema 1 ist hinsichtlich des Vorliegens und der Lage der Doppelbindungen in IV bzw. IVb nicht einschränkend zu verstehen.

A.1a Schritt a

59

- Die Kondensation von Arylaminen der allgemeinen Formel III mit 1,5-Dicarbonsäuren, vorzugsweise mit Dicarbonsäuren der in Schema 1 dargestellten allgemeinen Formel IV bzw. mit ihren Anhydriden IVa zu den entsprechenden N-Arylpiperidindionen bzw. zu den N-Aryl-1H,3H-dihydropyridin-2,6-dionen der allgemeinen Formel II erfolgt in Anlehnung an bekannte Verfahren zur Herstellung derartiger Verbindungen, beispielsweise nach J.A. Seijas, J. Chem. Res. Synop. 1999, 7, 420-421; V.R. Ranade, J. Indian Chem. Soc. 1979, 56, 393-395; G.W. Joshi, Indian J. Chem. 1981, 20 B, 1050-1052; A.K. Ghosal, Indian J. Chem. 1978, 16B, 200-204. Auf die Offenbarung dieser Schriften wird hiermit in vollem Umfang Bezug genommen.
- Bevorzugt ist die Umsetzung von einer Dicarbonsäure IV bzw. ihrem Doppelbindungsisomer mit dem Anilinderivat der allgemeinen Formel III. Die Umsetzung erfolgt in der Regel durch Erwärmen der Komponenten in einem inerten Lösungsmittel oder in der Schmelze, vorzugsweise auf Temperaturen oberhalb 100 °C und insbesondere auf Temperaturen im Bereich von 120 bis 300 °C (siehe auch V.R. Ranade, loc. cit.).
- Geeignete Lösungsmittel sind aromatische und aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, Xylol, Isopropylbenzol, p-Cumol, Decalin und vergleichbare sowie hochsiedende Ether, z. B. Dimethyldiethylenglykol und Dimethyltriethylenglykol, und Mischungen der vorgenannten Lösungsmittel.
- Anstelle durch Einwirkung erhöhter Temperatur kann man Schritt a auch durch Einwirkung von Zentimeterwellen (Mikrowellen) bewirken (siehe hierzu J.A. Seijas, loc. cit.). Auch hier kann die Umsetzung in einem der vorgenannten Lösungsmittel oder einem Verdünnungsmittel oder in einer innigen Mischung der Komponenten erfolgen.
- Vorzugsweise setzt man die Komponenten des Kondensations-schritts a, d. h. die 1,5-Dicarbonsäure IV bzw. ihr Anhydrid IVa und das Arylamin III, in etwa äquimolaren Mengen ein. Selbstverständlich ist es jedoch auch möglich, eine dieser Komponenten im Überschuss einzusetzen.
- Die Aufarbeitung der Reaktionsmischung des Kondensations-schritts a zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel II erfolgt nach bekannten Verfahren, beispielsweise durch Kristallisation, wässrig-extraktive Aufarbeitung oder durch chromatographische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden. Selbstverständlich kann die Verbindung II auch ohne

60

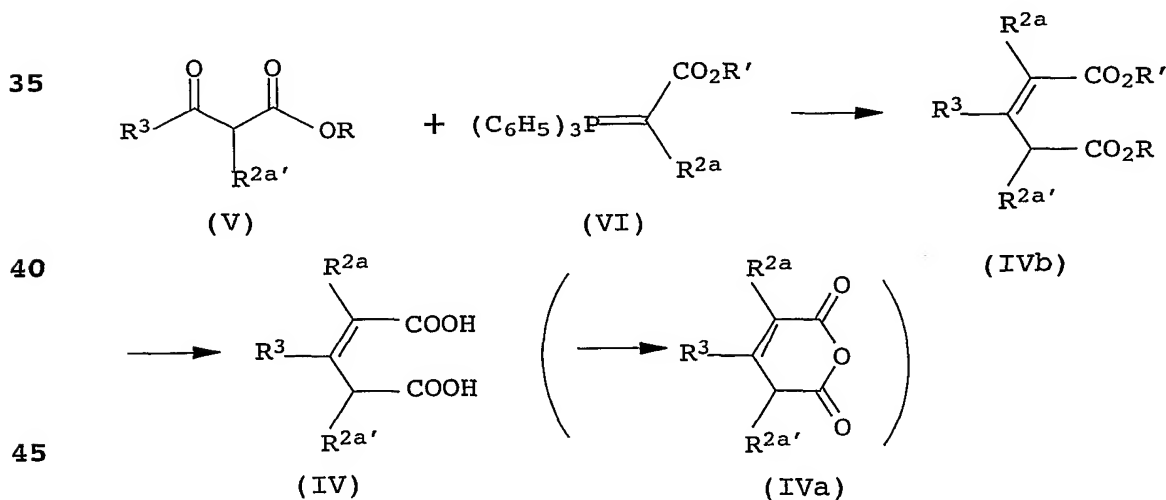
Zwischenisolierung oder Reinigung direkt im Folgeschritt eingesetzt werden.

Der in Schema 1 gezeigte Kondensationsschritt a kann sowohl einstufig als auch über Zwischenstufen, z. B. über acyclische Amide erfolgen, insbesondere, wenn zur Kondensation das Anhydrid IVa eingesetzt wird (vergleiche G.W. Joshi, loc. cit. sowie A.K. Gosal, loc. cit.). Die Cyclisierung gegebenenfalls auftretender acyclischer Amide kann sowohl thermisch, d. h. durch Umsetzung des Amids in einem hochsiedenden Lösungsmittel oder in der Schmelze oder in Gegenwart Wasser entziehender Mittel wie Essigsäureanhydrid, Oxalylchlorid oder vergleichbare Reagenzien und/oder in Gegenwart einer Base wie Piperidin, Pyridin, Dimethylaminopyridin oder Triethylamin erfolgen.

Die im Kondensationsschritt eingesetzten Arylamine der allgemeinen Formel III sind beispielsweise aus P. Böger und K. Wakabayashi, Peroxidizing Herbicides, Springer Verlag 1999, S. 21 ff und dort zitierte Literatur bekannt oder können analog der in der WO 01/12625 oder WO 97/08170 beschriebenen Verfahren hergestellt werden.

Die 1,5-Dicarbonsäuren der allgemeinen Formel IV können nach bekannten Methoden zur Herstellung von 1,5-Dicarbonsäuren hergestellt werden. Insbesondere bietet sich die in Schema 2 dargestellte Synthesesequenz zur Herstellung der Dicarbonsäuren IV an. Die in Schema 2 gezeigte Synthesesequenz lehnt sich an das von M. Guillaume, Synthesis 1995, 920-922 beschriebene Verfahren an.

Schema 2:



61

In Schema 2 haben R^{2a} , $R^{2a'}$ und R^3 die zuvor genannten Bedeutungen. R und R' stehen für verseifbare Reste, vorzugsweise für C_1 - C_4 -Alkylreste wie Methyl oder Ethyl. Schema 2 ist hinsichtlich der Lage der Doppelbindung in den Verbindungen IV und IVa nicht einschränkend gemeint.

Der erste Schritt in Schema 2 ist die Umsetzung eines 2-Halogenacylalkancarbonsäureesters (z.B. eines 2-Halogenacylessigesters, wenn $R^{2a'} = H$ oder eines 2-Halogenacylpropionsäureesters, wenn $R^{2a'} = CH_3$) der allgemeinen Formel V mit einem Wittig-Reagenz, beispielsweise einem Phosphorylen der allgemeinen Formel VI. Hierbei werden die 3-Halogenalkyl-1,5-dicarbonsäureester der allgemeinen Formel IVb erhalten. Dieser Schritt erfolgt unter den für eine Wittig-Reaktion üblichen Reaktionsbedingungen, wie sie beispielsweise in "Organikum", 16. Auflage, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1986, S. 486, in M. Guillaume, Synthesis 1995, 920-922, sowie in den bei J. March, Advanced Organic Chemistry 2nd Edition, Wiley Interscience 1985, S. 845-854 zur Wittig-Reaktion zitierten Literaturstellen beschrieben werden.

Die anschließende Verseifung der Dicarbonsäureester IVb zu den Dicarbonsäuren IV erfolgt nach Standardverfahren, beispielsweise durch Umsetzung von IVb mit Alkalien wie Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid in geeigneten Lösungsmitteln, beispielsweise in Wasser, Alkoholen oder in Wasser/Alkohol-Mischungen bei Temperaturen im Bereich von 0 bis 200 °C, vorzugsweise oberhalb 0 °C, z. B. in der Siedehitze oder bei Raumtemperatur.

Die Umwandlung der Dicarbonsäuren IV in ihre Anhydride IVa erfolgt ebenfalls nach Standardmethoden, beispielsweise durch Erhitzen und/oder in Gegenwart Wasser entziehender Mittel wie Essigsäureanhydrid (G.W. Joshi, Loc. cit.; A. Nangia, Synth. Commun. 1992, 22, 593-602) oder in Gegenwart von Carbodiimiden wie Dicyclohexylcarbodiimid (vergleiche N.M. Gray, J. Med. Chem. 1991, 34, 1283-1292). Auf die zu Schema 2 genannten Druckschriften wird hiermit in vollem Umfang Bezug genommen.

A.1b Schritt b

Zur Umwandlung des nach Schema 1 erhaltenen primären Kondensationsprodukts der allgemeinen Formel II in Verbindungen der Formel I, worin R^1 für ein Halogenatom steht, wird man die Verbindung II mit einem Halogenierungsmittel, vorzugsweise einem sauren Halogenierungsmittel wie Phosphortrihalo-

genid, z. B. Phosphortrichlorid, Phosphor(V)halogenid, z. B. Phosphorpentachlorid, oder Phosphoroxotrihalogenid, z. B. POCl_3 , umsetzen, wobei die zuletzt genannten Halogenierungsmittel bevorzugt sind (siehe hierzu auch M.S. Mayadeo, Indian J. Chem. 1987, 1099-1101 sowie Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd 5/3, 1962, 4. Auflage, S. 899ff und 905ff, auf die hiermit in vollem Umfang Bezug genommen wird). Hierbei entstehen Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin R^1 für Halogen und insbesondere für Chlor steht.

10

Die Umsetzung mit dem Halogenierungsmittel kann in einem inerten organischen Lösungsmittel, beispielsweise einem der vorgenannten aromatischen oder aliphatischen Kohlenwasserstoffe und/oder einem halogenierten Kohlenwasserstoff wie Dichlormethan, Dichlorethan, Dichlorethen oder Trichlorethan oder in dem Halogenierungsmittel als Lösungsmittel erfolgen. In der Regel erfolgt die Umsetzung unter Erwärmen oder unter Einwirkung von Zentimeterwellen.

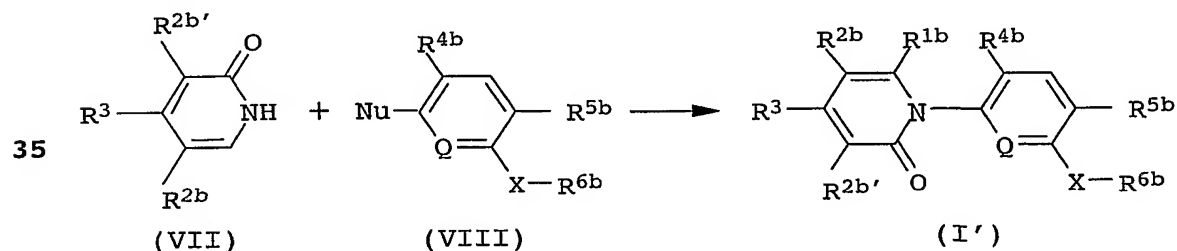
20

A.2 Nucleophile Substitution

Verbindungen der allgemeinen Formel I mit $\text{R}^1 = \text{Wasserstoff}$ können durch Umsetzung von geeignet substituierten 2-[1H]-Pyridonen der allgemeinen Formel VII mit nucleophil substituierbaren aromatischen Verbindungen der allgemeinen Formel VIII nach der in Schema 3 gezeigten Synthesesequenz hergestellt werden.

30

Schema 3:



40

In Schema 3 haben die Variablen Q , X und R^3 die zuvor genannten Bedeutungen. R^{1b} , R^{2b} und $\text{R}^{2b'}$ stehen für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl. R^{4b} , R^{5b} und R^{6b} haben die zuvor für R^4 , R^5 und R^6 genannten Bedeutungen oder stehen für Substituenten, die nach bekannten Verfahren in Substituenten R^4 , R^5 und R^6 umgewandelt werden können. Nu steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, vorzugsweise für ein Halogenatom und insbesondere für Chlor und speziell für Fluor. Vorzugsweise steht in Schema 3 R^{5b} für einen Elektronen ziehenden Rest, insbesondere

45

63

für eine Cyano-Gruppe oder Halogen. Bei der Umsetzung von VII mit VIII gemäß Schema 3 werden Verbindungen der allgemeinen Formel I' erhalten, aus denen weitere Verbindungen der allgemeinen Formel I durch Umwandlung der Gruppen R^{2b} bis R^{6b} nach bekannten Methoden, beispielsweise nach den unter B) und C) beschriebenen Verfahren, hergestellt werden können.

Die Umsetzung von VII mit VIII zu den Verbindungen I' kann beispielsweise in Anlehnung an die in der EP 259 048 bzw. GB 8621217 beschriebenen Methoden erfolgen. Vorzugsweise führt man diese Umsetzung in Gegenwart einer Base, vorzugsweise einem Alkalimetallhydrid wie Natriumhydrid oder einem Alkalimetallcarbonat wie Natriumcarbonat oder Kaliumcarbonat durch. Gegebenenfalls kann man zur Katalyse Kupfer oder Kupfersalze zusetzen. Gegebenenfalls kann man als Hilfskatalysator noch einen Kronenether zusetzen.

Vorzugsweise erfolgt die Umsetzung in einem Lösungsmittel, insbesondere einem polaren, aprotischen Lösungsmittel wie Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Dimethylacetamid, einem Ether wie Diethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan sowie Mischungen dieser Lösungsmittel.

In der Regel wird man die Umsetzung bei Temperaturen oberhalb Raumtemperatur, vorzugsweise im Bereich von 50 bis 200 °C durchführen. Hierzu setzt man die Verbindungen der allgemeinen Formel VII und VIII vorzugsweise in annähernd äquimolaren Mengen ein. Selbstverständlich kann man auch eine Komponente im Überschuss einsetzen, wobei der Überschuss vorzugsweise nicht mehr als 50 Mol-%, insbesondere nicht mehr als 20 Mol-%, bezogen auf die im Unterschuss vorliegende Komponente betragen wird.

Pyridone der allgemeinen Formel VII sind bekannt und teilweise kommerziell erhältlich oder können in Analogie zu bekannten Verfahren zur Herstellung von Pyridonen synthetisiert werden. Beispielsweise gelingt die Herstellung von Pyridonen der allgemeinen Formel VII aus geeignet substituierten 2-Chlorpyridinen. Hierzu wird das 2-Chlorpyridin sukzessive in seinen Benzylether überführt (vergleiche A.J.S. Duggan et al., Synthesis 1980, 7, 573 sowie A. Loupy et al., Heterocycles 1991, 32, 1947-1953; auf diese Schriften wird hiermit Bezug genommen) und anschließende Hydrogenolyse nach der von T.W. Greene, Protective Groups in Organic Synthesis, 3. Auflage 1999, S. 266ff beschriebenen Methode.

64

Verbindungen der allgemeinen Formel VIII sind kommerziell erhältlich oder können nach bekannten Methoden, z.B. durch Sandmeyer-Reaktion aus den entsprechenden Anilinen II (vgl. Böger et al. in Peroxidising Herbicides) hergestellt werden.

5

Selbstverständlich können im Anschluss an die Herstellung von I' die darin enthaltenen Substituenten R^{1b} bis R^{6b} in andere Substituenten R^1 bis R^6 umgewandelt werden. Verfahren hierzu sind bekannt und beispielsweise in den nachfolgenden Abschnitten B) und C) beschrieben.

10

B) Funktionalisierung der Substituenten am Pyridonteil von I

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin A für ein Sauerstoffatom steht, können nach bekannten Methoden durch Behandlung mit Schwefelungsmitteln in Verbindungen der allgemeinen Formel I umgewandelt werden, worin A für ein Schwefelatom steht. Beispiele für geeignete Schwefelungsmittel sind Phosphor(V)sulfide, Organozinnsulfide sowie Organophosphorsulfide (siehe auch J. March, Advanced Organic Synthesis, 2nd Edition, Wiley Interscience 1985, S. 794 und dort zitierte Literatur). Die Umsetzung kann in einem Lösungsmittel oder in Substanz durchgeführt werden. Geeignete Lösungsmittel sind die oben genannten, inerten Lösungsmittel sowie basische Lösungsmittel, z. B. Pyridin und vergleichbare. Die zur Umsetzung erforderliche Temperatur liegt in der Regel oberhalb Raumtemperatur und liegt insbesondere im Bereich von 50 bis 200 °C.

20

25

30

Verbindungen der allgemeinen Formel I, in denen R^2 bzw. $R^{2'}$ für Wasserstoff stehen, können auch nach bekannten Verfahren zur Funktionalisierung von Pyridonen in Verbindungen umgewandelt werden, in denen R^2 bzw. $R^{2'}$ für eine Aminogruppe stehen.

35

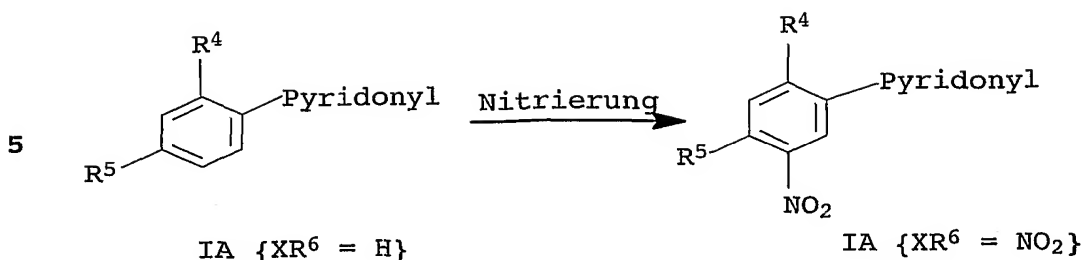
Die Herstellungen von Verbindungen I, in denen einer oder beide der Reste R^2 bzw. $R^{2'}$ für Amino steht, erfolgt durch sukzessive Nitrierung und Hydrierung in Anlehnung an die Vorgehensweise der DE-A 20 55 513.

40 C)

Verbindungen I mit $Q = CH$ steht (Verbindungen IA), können durch Funktionalisierung des Phenylrings in andere Verbindungen IA umgewandelt werden. Beispiele hierfür sind:

45

C.1 Nitrierung von 1-Arylpyridonen IA, in denen XR^6 für Wasserstoff steht, und Umsetzung der Verfahrensprodukte zu weiteren Verbindungen der Formel IA:



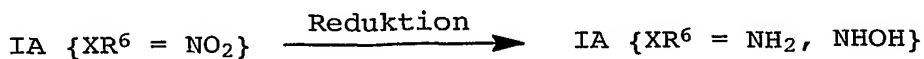
10 Als Nitrierungsreagenzien kommen beispielsweise Salpetersäure in unterschiedlicher Konzentration, auch konzentrierte und rauchende Salpetersäure, Mischungen von Schwefelsäure und Salpetersäure, außerdem Acetylnitrate und Alkylnitrate in Betracht.

15 Die Reaktion kann entweder lösungsmittelfrei in einem Überschuss des Nitrier-Reagenzes oder in einem inerten Lösungs- oder Verdünnungsmittel durchgeführt werden, wobei z.B. Wasser, Mineralsäuren, organische Säuren, Halogenkohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Anhydride wie Essigsäureanhydrid
20 und Mischungen dieser Solventien geeignet sind.

Ausgangsverbindung IA $\{ \text{XR}^6 = \text{H} \}$ und Nitrier-Reagenz werden zweckmäßigerweise in etwa äquimolaren Mengen eingesetzt; zur
25 Optimierung des Umsatzes an Ausgangsverbindung kann es jedoch vorteilhaft sein, das Nitrier-Reagenz im Überschuss zu verwenden, bis etwa zur 10fachen molaren Menge, bezogen auf IA. Bei der Reaktionsführung ohne Lösungsmittel im Nitrier-Reagenz liegt dieses in einem noch größeren Überschuss vor.

30 Die Reaktionstemperatur liegt normalerweise bei -100°C bis 200°C , bevorzugt bei -30 bis 50°C .

35 Die Verbindungen IA mit $\text{XR}^6 = \text{NO}_2$ können dann zu Verbindungen IA mit $\text{X-R}^6 = \text{NH}_2$ oder $-\text{NHOH}$ reduziert werden:



40 Die Reduktion wird in der Regel durch Umsetzung der Nitroverbindung mit einem Metall wie Eisen, Zink oder Zinn unter sauren Reaktionsbedingungen oder mit einem komplexen Hydrid wie Lithiumaluminiumhydrid oder Natriumborhydrid erfolgen, wobei die Reduktion in Substanz oder in einem Lösungs- oder Verdünnungsmittel durchgeführt werden kann. Als Lösungsmittel
45 kommen - in Abhängigkeit vom gewählten Reduktionsmittel - z.B. Wasser, Alkohole wie Methanol, Ethanol und Isopropanol

66

oder Ether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dioxan, Tetrahydrofuran und Ethylenglykoldimethylether, in Betracht.

- Bei der Reduktion mit einem Metall arbeitet man vorzugsweise lösungsmittelfrei in einer anorganischen Säure, insbesondere in konzentrierter oder verdünnter Salzsäure, oder in einer flüssigen organischen Säure wie Essigsäure oder Propionsäure. Man kann die Säure jedoch auch mit einem inerten Lösungsmittel, z.B. einem der vorstehend genannten, verdünnen. Die Reduktion mit komplexen Hydriden erfolgt vorzugsweise in einem Lösungsmittel, beispielsweise einem Ether oder einem Alkohol.
- Die Nitroverbindung IA $\{X-R^6 = NO_2\}$ und das Reduktionsmittel werden häufig in etwa äquimolaren Mengen eingesetzt; zur Optimierung des Reaktionsverlaufes kann es vorteilhaft sein, eine der beiden Komponenten im Überschuss zu verwenden, bis etwa zur 10fachen molaren Menge.
- Die Menge an Säure ist nicht kritisch. Um die Ausgangsverbindung möglichst vollständig zu reduzieren, verwendet man zweckmäßigerweise mindestens eine äquivalente Menge an Säure. Häufig wird die Säure im Überschuss bezogen auf IA $\{X-R^6 = NO_2\}$ eingesetzt.
- Die Reaktionstemperatur liegt im Allgemeinen im Bereich von $-30^\circ C$ bis $200^\circ C$, bevorzugt im Bereich von $0^\circ C$ bis $80^\circ C$.
- Zur Aufarbeitung wird die Reaktionsmischung in der Regel mit Wasser verdünnt und das Produkt durch Filtration, Kristallisation oder Extraktion mit einem Lösungsmittel, das mit Wasser weitgehend unmisierbar ist, z.B. mit Essigsäureethylester, Diethylether oder Methylenchlorid, isoliert. Gewünschtenfalls kann das Produkt anschließend wie üblich gereinigt werden.
- Die Nitrogruppe der Verbindungen IA $\{X-R^6 = NO_2\}$ kann auch katalytisch mittels Wasserstoff hydriert werden. Hierfür geeignete Katalysatoren sind beispielsweise Raney-Nickel, Palladium auf Kohle, Palladiumoxid, Platin und Platinoxid, wobei im allgemeinen eine Katalysatormenge von 0,05 bis 10,0 Mol-%, bezogen auf die zu reduzierende Verbindung, ausreichend ist.

67

Man arbeitet entweder lösungsmittelfrei oder in einem inerten Lösungs- oder Verdünnungsmittel, z.B. in Essigsäure, einem Gemisch aus Essigsäure und Wasser, Essigsäureethylester, Ethanol oder in Toluol.

5

Nach Abtrennen des Katalysators kann die Reaktionslösung wie üblich auf das Produkt hin aufgearbeitet werden.

10

Die Hydrierung kann bei Normalwasserstoffdruck oder unter erhöhtem Wasserstoffdruck durchgeführt werden.

Die Aminogruppe in IA $\{X-R^6 = NH_2\}$ kann anschließend in üblicher Weise diazotiert werden. Aus den Diazoniumsalzen sind dann Verbindungen I zugänglich mit:

15

- $X-R^6$ = Cyano oder Halogen {z.B. durch Sandmeyer-Reaktion: vgl. beispielsweise Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart, Bd. 5/4, 4. Auflage 1960, S. 438ff.},

20

- $X-R^6$ = Hydroxy {z.B. durch Phenolverkochung: vgl. beispielsweise Org. Synth. Coll. Vol. 3 (1955), S. 130},

- $X-R^6$ = Mercapto oder C_1-C_6 -Alkylthio {vgl. hierzu beispielsweise Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart, Bd. E11 1984, S. 43 und 176},

25

- $X-R^6$ = Halogensulfonyl {vgl. hierzu beispielsweise Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart, Bd. E11 1984, S. 1069f.},

30

- $X-R^6$ = z.B. $-CH_2-CH(\text{Halogen})-CO-O-Y-R^8$, $-CH=C(\text{Halogen})-CO-O-Y-R^8$, $-CH_2-CH(\text{Halogen})-PO-(O-Y-R^8)_2$, $-CH=C(\text{Halogen})-PO-(O-Y-R^8)_2$ {allgemein handelt es sich hierbei um Produkte einer Meerwein-Arylierung; vgl. hierzu beispielsweise C.S. Rondestredt, Org. React. 11, 189 (1960) und H.P. Doyle et al., J. Org. Chem. 42, 2431 (1977)}.

35

Das jeweilige Diazoniumsalz von IA $\{X-R^6 = N_2^+\}$ stellt man in der Regel auf an sich bekannte Weise durch Umsetzung von IA $\{X-R^6 = NH_2\}$ mit einem Nitrosierungsmittel, z.B. einem Nitrit wie Natriumnitrit und Kaliumnitrit in einer wässrigen Säurelösung, z.B. in Salzsäure, Bromwasserstoffsäure oder Schwefelsäure, her.

40

45

Die Aminoverbindung IA $\{X-R^6 = NH_2\}$ kann man zur Herstellung des Diazoniumsalzes IA $\{X-R^6 = N_2^+\}$ mit einem Salpetrigsäureester wie tert.-Butylnitrit und Isopentylnitrit unter wasserfreien Reaktionsbedingungen umsetzen, z.B. in Chlorwasser-

68

stoff haltigem Eisessig, in absolutem Alkohol, in Dioxan oder Tetrahydrofuran, in Acetonitril oder in Aceton.

5 Die Überführung des so erhaltenen Diazoniumsalzes in die entsprechende Verbindung IA mit $X-R^6 = \text{Cyano, Chlor, Brom oder Iod}$ erfolgt besonders bevorzugt durch Behandeln mit einer Lösung oder Suspension eines Kupfer(I)salzes wie Kupfer(I)cyanid, -chlorid, -bromid und iodid, oder mit einer Alkalimetallsalz-Lösung (vgl. A1).

10 Die Überführung des so erhaltenen Diazoniumsalzes in die entsprechende Hydroxy-Verbindung IA $\{X-R^6 = \text{Hydroxyl}\}$ erfolgt zweckmäßigerweise durch Behandeln des Diazoniumsalzes IA mit einer wässrigen Säure, bevorzugt Schwefelsäure. Hierbei kann
15 sich der Zusatz eines Kupfer(II)salzes wie Kupfer(II)sulfat vorteilhaft auf den Reaktionsverlauf auswirken. Im Allgemeinen führt man diese Umsetzung bei 0 bis 100°C, vorzugsweise bei der Siedetemperatur des Reaktionsgemisches durch.

20 Verbindungen IA mit $X-R^6 = \text{Mercapto, C}_1\text{-C}_6\text{-Alkylthio oder Halogensulfonyl}$ erhält man z.B. durch Umsetzung des entsprechenden Diazoniumsalzes von IA mit Schwefelwasserstoff, einem Alkalimetallsulfid, einem Dialkyldisulfid wie Dimethyldisulfid, oder mit Schwefeldioxid.

25 Bei der Meerwein-Arylierung handelt es sich üblicherweise um die Umsetzung der Diazoniumsalze mit Alkenen oder Alkinen. Das Alken oder Alkin wird dabei vorzugsweise im Überschuss, bis etwa 3000 Mol-%, bezogen auf die Menge des Diazoniumsalzes, eingesetzt.
30

Die vorstehend beschriebenen Umsetzungen des Diazoniumsalzes IA $\{X-R^6 = N_2^+\}$ können z.B. in Wasser, in wässriger Salzsäure oder Bromwasserstoffsäure, in einem Keton wie Aceton,
35 Diethylketon und Methylethylketon, in einem Nitril wie Acetonitril, in einem Ether wie Dioxan und Tetrahydrofuran oder in einem Alkohol wie Methanol und Ethanol erfolgen.

40 Sofern nicht bei den einzelnen Umsetzungen anders angegeben liegen die Reaktionstemperaturen normalerweise bei -30°C bis 50°C.

Bevorzugt werden alle Reaktionspartner in etwa stöchiometrischen Mengen eingesetzt, jedoch kann auch ein Überschuss
45 der einen oder anderen Komponente, bis etwa 3000 Mol-%, von Vorteil sein.

69

Die Mercapto-Verbindungen IA $\{X-R^6 = SH\}$ sind auch durch Reduktion der nachstehend beschriebenen Verbindungen IA mit $X-R^6 =$ Halogensulfonyl erhältlich. Brauchbare Reduktionsmittel sind z.B. Übergangsmetalle wie Eisen, Zink und Zinn (vgl. hierzu beispielsweise "The Chemistry of the Thiol Group", John Wiley, 1974, S. 216).

C.2 Halosulfonierung von 1-Arylpuridonen IA, bei denen XR^6 für Wasserstoff steht:



Die Halosulfonierung kann ohne Lösungsmittel in einem Überschuss an Sulfonierungsreagenz oder in einem inerten Lösungs-/Verdünnungsmittel, z.B. in einem halogenierten Kohlenwasserstoff, einem Ether, einem Alkylnitril oder einer Mineralsäure durchgeführt werden.

Chlorsulfonsäure stellt sowohl das bevorzugte Reagenz als auch Lösungsmittel dar.

20 Das Sulfonierungsreagenz wird normalerweise in einem leichten Unterschuss (bis etwa 95 mol-%) oder in einem Überschuss von der 1- bis 5fachen molaren Menge, bezogen auf die Ausgangsverbindung IA (mit $X-R^6 = H$) eingesetzt. Arbeitet man ohne inertes Lösungsmittel, so kann auch ein noch größerer Überschuss zweckmäßig sein.

Die Reaktionstemperatur liegt normalerweise zwischen 0°C und dem Siedepunkt des Reaktionsgemisches.

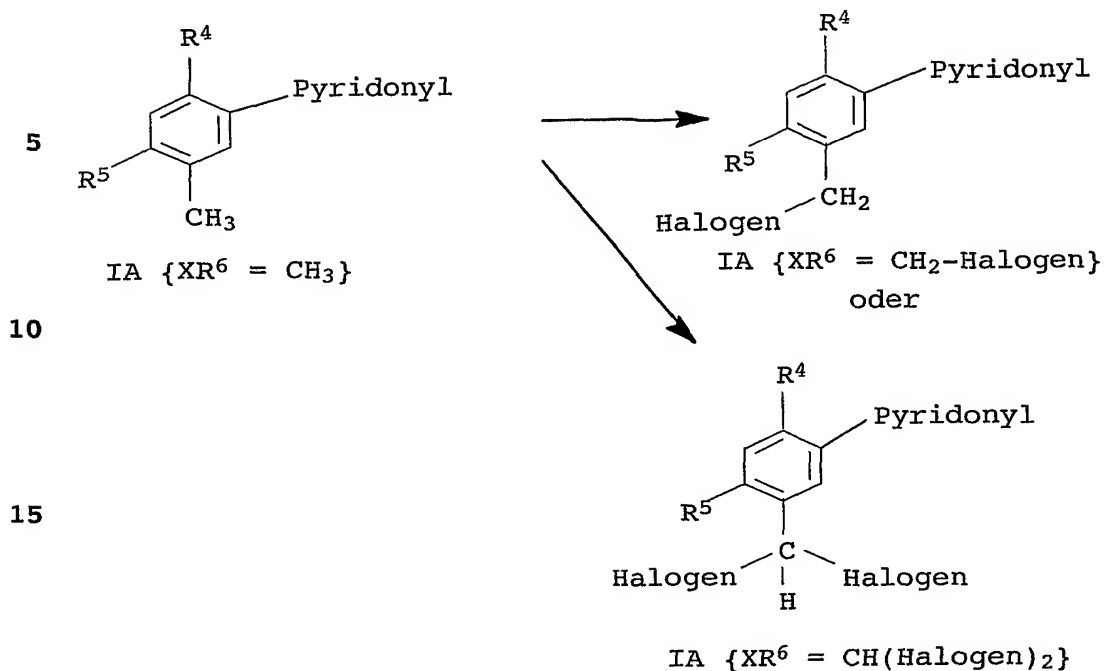
30 Zur Aufarbeitung wird die Reaktionsmischung z.B. mit Wasser versetzt, wonach sich das Produkt wie üblich isolieren lässt.

C.3 Seitenkettenhalogenierung von 1-Arylpuridonen IA, bei denen $X-R^6$ für Methyl steht, und Umsetzung der Verfahrensprodukte zu weiteren Verbindungen der Formel IA:

40

45

70



Beispiele für geeignete Lösungsmittel sind organische Säuren, anorganische Säuren, aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, die halogeniert sein können, sowie Ether, Sulfide, Sulfoxide und Sulfone.

Als Halogenierungsmittel kommen beispielsweise Chlor, Brom, N-Bromsuccinimide, N-Chlorsuccinimide oder Sulfurylchlorid in Betracht. Je nach Ausgangsverbindung und Halogenierungsmittel kann der Zusatz eines Radikalstarters, beispielsweise eines organischen Peroxides wie Dibenzoylperoxid oder einer Azoverbindung wie Azobisisobutyronitril, oder Bestrahlung mit Licht vorteilhaft auf den Reaktionsverlauf wirken.

Die Menge an Halogenierungsmittel ist nicht kritisch. Sowohl unterstöchiometrische Mengen als auch große Überschüsse an Halogenierungsmittel, bezogen auf die zu halogenierende Verbindung IA (mit X-R⁶ = Methyl), sind möglich.

Bei Verwendung eines Radikalstarters ist üblicherweise eine katalytische Menge davon ausreichend.

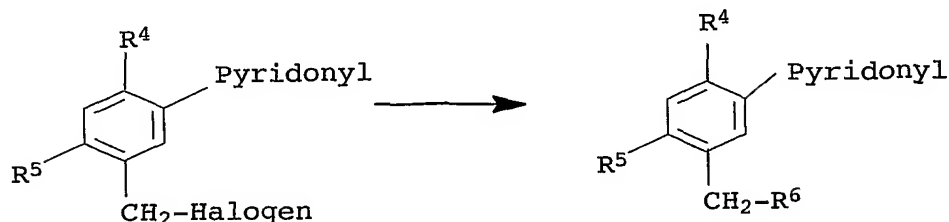
Die Reaktionstemperatur liegt normalerweise bei -100°C bis 200°C, vornehmlich bei 10 bis 100°C oder dem Siedepunkt des Reaktionsgemisches.

71

Diejenigen Halogenierungsprodukte IA mit $X-R^6 = CH_2\text{-Halogen}$ lassen sich in einer nucleophilen Substitutionsreaktion gemäß dem folgenden Schema in ihre entsprechenden Ether, Thioether, Ester, Amine oder Hydroxylamine überführen:

5

10



IA $\{XR^6 = CH_2\text{-Halogen}\}$

IA $\{X = CH_2; R^6 = -O-Y-R^8, -O-CO-Y-R^8, -N(Y-R^8)(Z-R^9), -N(Y-R^8)(-O-Z-R^9), -S-Y-R^8\}$

15

20

Als Nucleophil verwendet man entweder die entsprechenden Alkohole, Thiole, Carbonsäuren oder Amine, wobei dann vorzugsweise in Gegenwart einer Base (z.B. eines Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxids oder eines Alkali- oder Erdalkalimetallcarbonats) gearbeitet wird, oder man verwendet die durch Reaktion der Alkohole, Thiole, Carbonsäuren oder Amine mit einer Base (z.B. einem Alkalimetallhydrid) erhaltenen Alkalimetallsalze dieser Verbindungen.

25

Als Lösungsmittel kommen vor allem aprotische organische Solventien, z.B. Tetrahydrofuran, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, oder Kohlenwasserstoffe wie Toluol und n-Hexan, in Betracht.

30

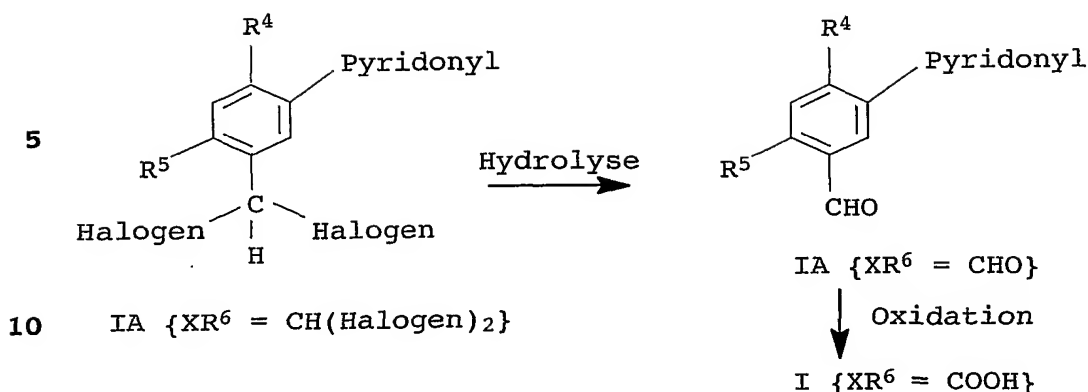
Die Reaktionsführung erfolgt bei einer Temperatur zwischen dem Schmelz- und dem Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise bei 0 bis 100°C.

35

Diejenigen Halogenierungsprodukte IA mit $X-R^6 = CH(\text{Halogen})_2$ können zu den entsprechenden Aldehyden (IA mit $X-R^6 = CHO$) hydrolysiert werden. Letztere wiederum können in Analogie zu bekannten Verfahren zu den Carbonsäuren IA $\{X-R^6 = COOH\}$ oxidiert werden:

40

45

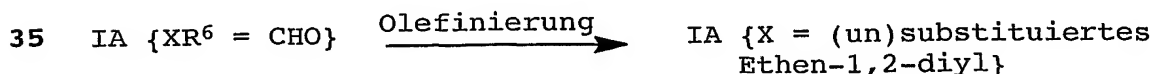


15 Die Hydrolyse der Verbindungen IA mit X-R⁶ = Dihalogenmethyl erfolgt vorzugsweise unter sauren Bedingungen, insbesondere lösungsmittelfrei in Salzsäure, Essigsäure, Ameisensäure oder Schwefelsäure, oder auch in einer wässrigen Lösung einer der genannten Säuren, z.B. in einer Mischung aus Essigsäure und Wasser (beispielsweise 3:1).

20 Die Reaktionstemperatur liegt normalerweise bei 0 bis 120°C.

25 Die Oxidation der Hydrolyseprodukte IA mit XR⁶ = Formyl zu den entsprechenden Carbonsäuren kann auf an sich bekannte Weise erfolgen, z.B. nach Kornblum (siehe hierzu insbesondere die Seiten 179 bis 181 des Bandes "Methods for the Oxidation of Organic Compounds" von A.H. Haines, Academic Press 1988, in der Serie "Best Synthetic Methods"). Als Lösungsmittel ist beispielsweise Dimethylsulfoxid geeignet.

30 Die Aldehyde IA {X-R⁶ = CHO} lassen sich auch auf an sich bekannte Weise zu Verbindungen IA mit X = unsubstituiertes oder substituiertes Ethen-1,2-diyl olefinieren:



40 Die Olefinierung erfolgt vorzugsweise nach der Methode von Wittig oder einer ihrer Modifikationen, wobei als Reaktionspartner Phosphorylide, Phosphoniumsalze und Phosphonate in Betracht kommen, oder durch Aldolkondensation.

45 Bei Verwendung eines Phosphoniumsalzes oder eines Phosphonats empfiehlt es sich, in Gegenwart einer Base zu arbeiten, wobei Alkalimetallalkyle wie n-Butyllithium, Alkalimetallhydride und -alkoholate wie Natriumhydrid, Natriumethanolat und Kalium-tert.-butanolat, sowie Alkalimetall- und Erdalkali-

73

metallhydroxide wie Calciumhydroxid, besonders gut geeignet sind.

5 Für eine vollständige Umsetzung werden alle Reaktionspartner in etwa stöchiometrischem Verhältnis eingesetzt; bevorzugt verwendet man jedoch einen Überschuss an Phosphorverbindung und/oder Base bis etwa 10 mol-%, bezogen auf die Ausgangsverbindung (IA mit $X-R^6 = CHO$).

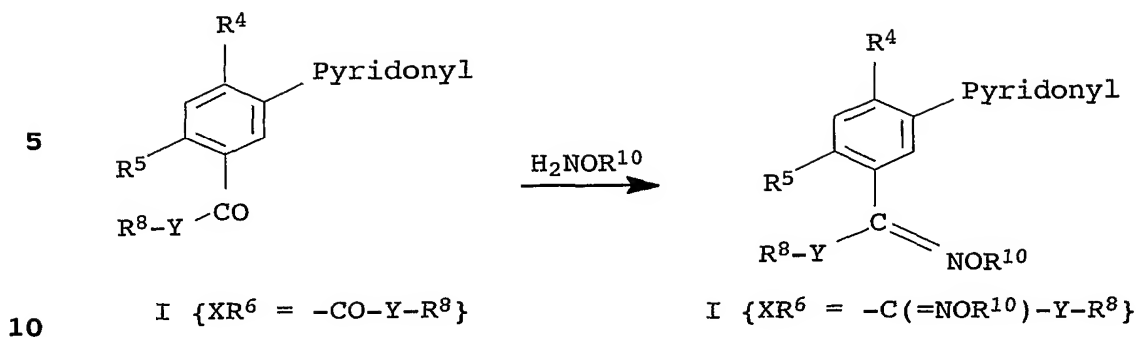
10 Im Allgemeinen liegt die Reaktionstemperatur bei -40 bis 150°C.

Die 1-Arylpyridone IA mit $X-R^6 = \text{Formyl}$ können auf an sich bekannte Weise in Verbindungen IA mit $X-R^6 = -CO-Y-R^8$ überführt werden, beispielsweise durch Umsetzung mit einer geeigneten Organometallverbindung $Me-Y-R^8$ - wobei Me für ein unedles Metall, vorzugsweise für Lithium oder Magnesium steht - und anschließender Oxidation der hierbei erhaltenen Alkohole (vgl. z.B. J. March, Advanced Organic Chemistry, 20 3rd ed., John Wiley, New York 1985, S. 816ff. und 1057ff.).

Die Verbindungen IA mit $X-R^6 = -CO-Y-R^8$ können ihrerseits in einer Reaktion nach Wittig weiter umgesetzt werden. Die hierfür als Reaktionspartner benötigten Phosphoniumsalze, 25 Phosphonate oder Phosphorylide sind bekannt oder lassen sich auf an sich bekannte Weise darstellen {vgl. hierzu z.B. Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. E1, S. 636ff. und Bd. E2, S. 345ff., Georg Thieme Verlag Stuttgart 1982; Chem. Ber. 95, 3993 (1962)}.

30 Weitere Möglichkeiten zur Herstellung anderer 1-Arylpyridone IA aus Verbindungen IA mit $X-R^6 = \text{Formyl}$ schließen die an sich bekannte Aldolkondensation ein, sowie Kondensations-Reaktionen nach Knoevenagel oder Perkin. Geeignete Bedingungen für diese Verfahren sind beispielsweise in Nielson, Org. 35 React. 16, 1ff (1968) {Aldolkondensation} Org. React. 15, 204ff. (1967) {Kondensation nach Knoevenagel} und Johnson, Org. React. 1, 210ff. (1942) {Kondensation nach Perkin} zu entnehmen.

40 Die Verbindungen IA mit $X-R^6 = -CO-Y-R^8$ können auch auf an sich bekannte Weise in ihre entsprechenden Oxime übergeführt werden {vgl. hierzu beispielsweise Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart, Bd. 10/4, 45 4. Auflage 1968, S. 55ff. und S. 73ff.}:



C.4 Synthese von Ethern, Thioethern, Aminen, Estern, Amiden, Sulfonamiden, Thioestern, Hydroximsäureestern, Hydroxylaminen, Sulfonsäurederivaten, Oximen oder Carbonsäurederivaten:

15 1-Arylpyridone IA, bei denen R⁶ Hydroxy, Amino, -NH-Y-R⁸, Hydroxylamino, -N(Y-R⁸)-OH, -NH-O-Y-R⁸, Mercapto, Halogensulfonyl, -C(=NOH)-Y-R⁸, Carboxy oder -CO-NH-O-Z-R⁹ bedeutet, können auf an sich bekannte Weise

20 mittels Alkylierung, Acylierung, Sulfonierung, Veresterung oder Amidierung in die entsprechenden Ether {IA mit R⁶ = -O-Y-R⁸}, Ester {I mit R⁶ = -O-CO-Y-R⁸}, Amine {I mit R⁶ = -N(Y-R⁸)(Z-R⁹)}, Amide {IA mit R⁶ = -N(Y-R⁸)-CO-Z-R⁹}, Sulfonamide {IA mit R⁶ = -N(Y-R⁸)-SO₂-Z-R⁹ oder

25 -N(SO₂-Y-R⁸)(SO₂-Z-R⁹)}, Hydroxylamine {IA mit R⁶ = -N(Y-R⁸)(O-Z-R⁹)}, Thioether {IA mit R⁶ = -S-Y-R⁸}, Sulfonsäurederivate {IA mit R⁶ = -SO₂-Y-R⁸, -SO₂-O-Y-R⁸ oder -SO₂-N(Y-R⁸)(Z-R⁹)}, Oxime (IA mit R⁶ = -C(=NOR¹⁰)-Y-R⁸}, Carbonsäurederivate {IA mit R⁶ = -CO-O-Y-R⁸, -CO-S-Y-R⁸,

30 -CO-N(Y-R⁸)(Z-R⁹), -CO-N(Y-R⁸)(O-Z-R⁹)} oder Hydroximsäureester {I mit R⁶ = -C(=NOR¹⁰)-O-Y-R⁸} überführt werden.

Derartige Umsetzungen werden beispielsweise in Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg Thieme Verlag Stuttgart (Bd. E16d, S. 1241ff.; Bd. 6/1a, 4. Auflage 1980, S. 262ff.; Bd. 8, 4. Auflage 1952, S. 471ff., 516ff., 655ff. und S. 686ff.; Bd. 6/3, 4. Auflage 1965, S. 10ff.; Bd. 9, 4. Auflage 1955, S. 103ff., 227ff., 343ff., 530ff., 659ff., 745ff. und S. 753ff.; Bd. E5, S. 934ff., 941ff. und

40 S. 1148ff.) beschrieben.

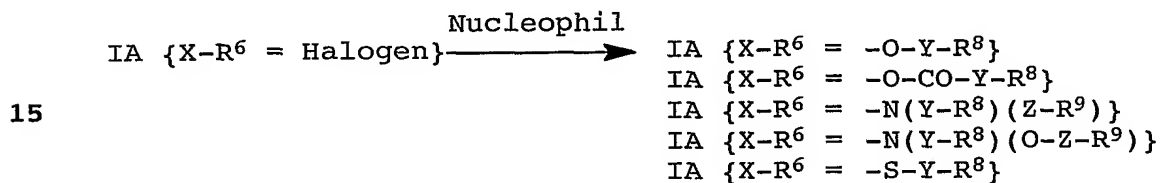
Beispielsweise können Ether (Verbindungen I mit X-R⁶ = O-Y-R⁸) in guten Ausbeuten durch Umsetzung der entsprechenden Hydroxyverbindung (Verbindung I mit X-R⁶ = OH) mit einem aliphatischen Halogenid Hal-Y-R⁸ (Hal = Chlor, Brom oder Iod)

45 hergestellt werden. Die Umsetzung erfolgt auf die für die Alkylierung von Phenolen beschriebene Art und Weise (siehe z.B.

75

zur Ethersynthese J. March "Advanced Organic Chemistry" 3rd ed. S. 342 f. und dort zitierte Literatur), vorzugsweise in Gegenwart einer Base wie NaOH oder einem Alkalimetallcarbonat oder Natriumhydrid. Als Reaktionsmedien werden aprotisch polare Lösungsmittel wie Dimethylformamid, N-Methylpyrrolidon oder Dimethylacetoneitril bevorzugt.

C.5 Nucleophile Substitution von Verbindung I, in denen X-R⁶ für Halogen steht. Das folgende Schema gibt Beispiele für die auf diesem Wege erhältlichen Verbindungsklassen.



Als Nucleophile kommen Alkohole, Thiole, Amine, Carbonsäuren oder CH-acide Verbindungen, z.B. Nitroalkane wie Nitromethan, Malonsäurederivate wie Diethylmalonat oder Cyanessigsäurederivate wie Cyanessigsäuremethylester in Betracht.

Diese Umsetzung gelingt besonders gut bei den Verbindungen IA, worin R⁵ für einen elektronenziehenden Rest, z.B. eine Trifluormethylgruppe oder eine Cyanogruppe, steht.

Vorzugsweise erfolgt die Umsetzung in Anwesenheit einer starken Base, z.B. eine der für A.2 genannten Basen. Selbstverständlich kann man die vorgenannten Nucleophile vor der Umsetzung mittels einer starken Base quantitativ deprotonieren. Hinsichtlich der Reaktionsbedingungen sei auf das unter A.2 Gesagte verwiesen. Außerdem wird hiermit auf J. March, Advanced Organic Synthesis, 3. Auflage 1985, S. 576 und die dort zitierte Literatur Bezug genommen.

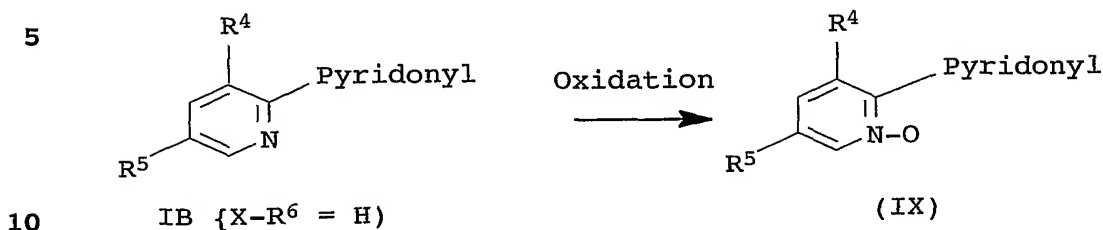
D) Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin Q ein Stickstoffatom bedeutet (Verbindungen IB).

Außer den bereits in den vorausgehenden Abschnitten A, B und C genannten Verfahren kommen hierzu insbesondere die folgenden Verfahren D.1 und D.2 in Betracht:

D.1 Halogenierung des Pyridinrings von Verbindungen IB mit X-R⁶ = H: Vorzugsweise wird hierzu ein 3-Pyridylpyridon der Formel IB (X-R⁶ = H) zunächst in das entsprechende Pyridin-N-oxid

76

der Formel IX überführt. In Formel IX haben R^1 , R^2 , R^4 und R^5 die zuvor genannten Bedeutungen.



Als Oxidationsmittel für diese Umsetzung kommen beispielsweise Wasserstoffperoxid oder organische Persäuren, z.B. Perameisensäure, Peressigsäure, Trifluorperessigsäure oder m-Chlorperbenzoesäure in Betracht.

Geeignete Lösungsmittel sind gegen Oxidation inerte organische Solventien, wie beispielsweise Kohlenwasserstoffe wie Toluol oder Hexan, Ether wie Diethylether, Dimethoxyethan, Methyl-t-butylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran, Alkohole wie Methanol oder Ethanol, oder auch Mischungen solcher Solventien untereinander oder mit Wasser. Wird mit einer organischen Persäure oxidiert, so kommt als Lösungsmittel vorzugsweise die zu Grunde liegende organische Säure, also beispielsweise Ameisen-, Essig- oder Trifluoressigsäure, in Betracht, gegebenenfalls in Mischung mit einem oder mehreren der vorgenannten Lösungsmittel.

Die Reaktionstemperatur liegt normalerweise zwischen Schmelz- und Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise bei 0-150°C.

Zur Erzielung einer hohen Ausbeute ist es häufig von Vorteil, das Oxidationsmittel im bis zu etwa fünffachen molaren Überschuss, bezogen auf eingesetztes IB (mit X- R^6 = H), einzusetzen.

Nachfolgend wird das Pyridin-N-oxid IX durch Umsetzung mit einem Halogenierungsmittel in IB (X- R^6 = Halogen) überführt.

40



45

Als Halogenierungsmittel kommen Phosphorylhalogenide wie POCl_3 oder POBr_3 , Phosphorhalogenide wie PCl_5 , PBr_5 , PCl_3 oder PBr_3 , Phosgen oder organische oder anorganische Säurehaloge-

77

nide wie z.B. Trifluormethansulfonsäurechlorid, Acetylchlorid, Bromacetylchlorid, Acetylchlorid, Benzoylchlorid, Benzoylbromid, Phthaloyldichlorid, Toluolsulfonsäurechlorid, Thionylchlorid oder Sulfurylchlorid in Betracht. Gegebenenfalls
 5 kann es von Vorteil sein, die Reaktion in Gegenwart einer Base, wie z.B. Trimethyl- oder Triethylamin oder Hexamethyldisilazan eingesetzt wird, durchzuführen.

Geeignete Lösungsmittel sind inerte organische Solventien,
 10 wie beispielsweise Kohlenwasserstoffe wie Toluol oder Hexan, Ether wie Diethylether, Dimethoxyethan, Methyl-t-butylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran, Amide wie DMF, DMA oder NMP, oder deren Mischungen. Wird mit einem flüssigen Halogenierungsmittel umgesetzt, kann dies vorzugsweise auch als Lösungsmittel, eventuell in Mischung mit einem der vorgenannten,
 15 zur Anwendung kommen.

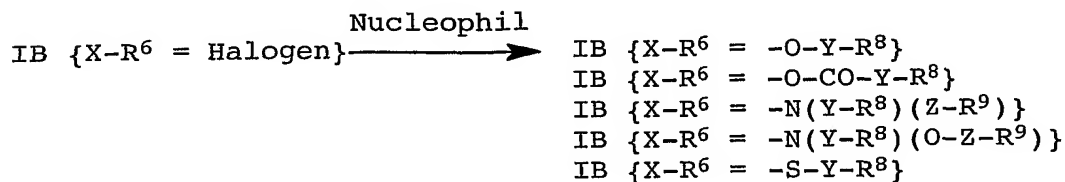
Die Reaktionstemperatur liegt normalerweise zwischen Schmelz- und Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise bei
 20 50-150°C.

Zur Erzielung einer hohen Ausbeute kann es vorteilhaft sein, Halogenierungsmittel oder Base im bis zu etwa fünffachen molaren Überschuss, bezogen auf eingesetztes IX, einzusetzen.

25

D.2 Nucleophile Substitution an Halogenpyridinen der Formel IB ($X-R^6$ = Halogen). Das folgende Schema gibt Beispiele für die auf diesem Wege erhältlichen Verbindungsklassen.

30



35

Als Nucleophile kommen Alkohole, Thiole, Amine, Carbonsäuren oder CH-acide Verbindungen, z.B. Nitroalkane wie Nitromethan,
 40 Malonsäurederivate wie Diethylmalonat oder Cyanessigsäurederivate wie Cyanessigsäuremethylester in Betracht. Für die Durchführung dieser Reaktion gilt das unter C.5 Gesagte.

E) Herstellung von Verbindungen der Formel I worin R^7 mit $X-R^6$
 45 für eine der Ketten $-N=C(R^{19})-S-$ (Verbindungen IC-1) oder $-N=C(R^{19})-O-$ steht (Verbindungen IC-2).

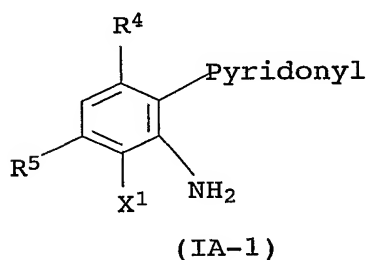
78

Zur Herstellung der Verbindungen IC sind auch die in den Abschnitten A und B genannten Verfahren anwendbar oder können zur Herstellung geeigneter Ausgangsverbindungen herangezogen werden.

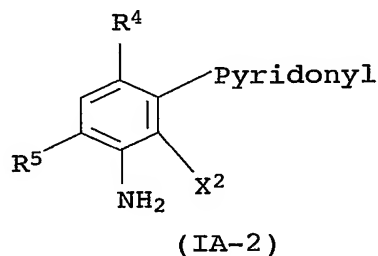
5

Des Weiteren können die Verbindungen IC-1 und IC-2 in Analogie zu bekannten Verfahren durch Ringschlussreaktion aus den entsprechenden ortho-Aminophenolen oder ortho-Mercaptoanilinen der Formeln IA-1 und IA-2 aufgebaut werden; hierzu sind zahlreiche Methoden aus der Literatur bekannt (s. z.B. Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. E8a, S.1028ff., Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart 1993 und Bd. E8b, S. 881ff., Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart 1994). In den Formeln IA-1 und IA-2 haben die Variablen "Pyridonyl", R⁴ und R⁵ die vorgenannten Bedeutungen oder stehen für Substituenten, die nach bekannten Methoden in diese Gruppen umgewandelt werden können. Die Variablen X¹ und X² stehen unabhängig voneinander für OH oder SH.

20



25



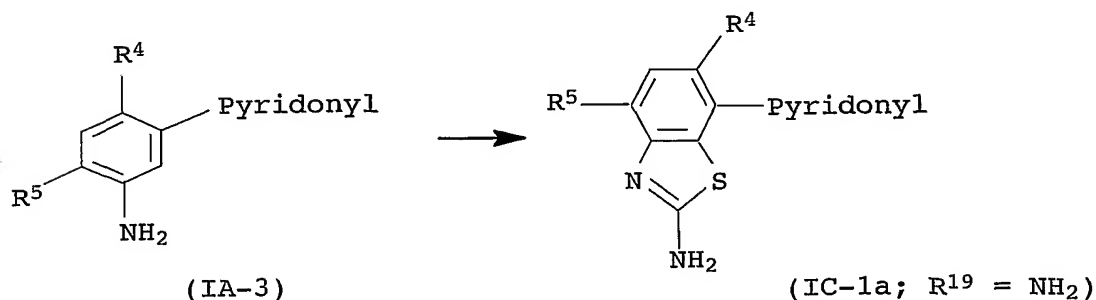
30

E.1 Verbindungen IC-1, worin R⁷ mit X-R⁶ eine der Ketten -N=C(R¹⁹)-S- bilden, können insbesondere auch durch das nachfolgend dargestellte Verfahren hergestellt werden:

35

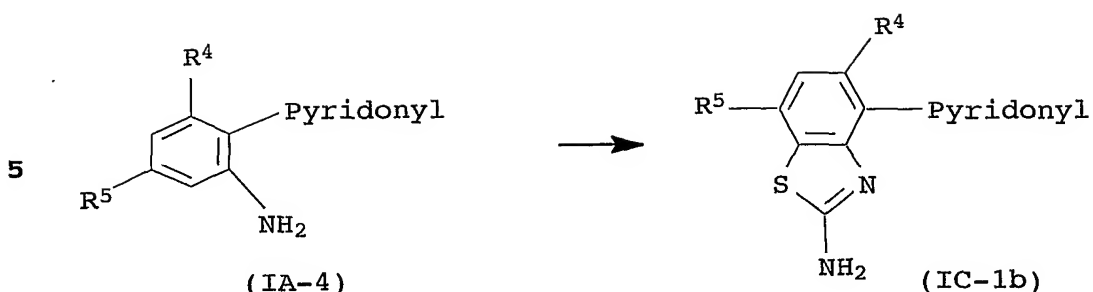
Dieses Verfahren umfasst die Umsetzung eines Aminophenylpyridons der Formel IA-3 oder IA-4 mit Halogen und Ammoniumthiocyanat oder mit einem Alkali- oder Erdalkalimetallthiocyanat. Hierbei werden Verbindungen der allgemeinen Formeln IC-1a bzw. IC-1b mit R¹⁹ = NH₂ erhalten.

40



45

79



10 Diese Verbindungen können durch nachfolgende Reaktionen an der Aminogruppe in andere Verbindungen IC-1a bzw. IC-1b umgewandelt werden.

15 Bevorzugtes Halogen ist Chlor oder Brom; unter den Alkali-/Erdalkalimetallthiocyanaten ist Natriumthiocyanat bevorzugt.

20 In der Regel führt man die Umsetzung in einem inerten Lösungsmittel, z.B. in einem Kohlenwasserstoff wie Toluol und Hexan, in einem halogenierten Kohlenwasserstoff wie Dichlormethan, in einem Ether wie Tetrahydrofuran, in einem Alkohol wie Ethanol, in einer Carbonsäure wie Essigsäure, oder in einem polar aprotischen Lösungsmittel wie Dimethylformamid, Acetonitril und Dimethylsulfoxid durch.

25 Die Reaktionstemperatur liegt normalerweise zwischen Schmelz- und Siedepunkt des Reaktionsgemisches, vorzugsweise bei 0 bis 150°C.

30 Zur Erzielung einer hohen Ausbeute an Wertprodukt setzt man vorzugsweise Halogen und Ammoniumthiocyanat bzw. Alkali-/Erdalkalimetallthiocyanat in etwa äquimolarer Menge oder im Überschuss, bis etwa zur 5-fachen molaren Menge, bezogen auf die Menge an IA-3 bzw. IA-4.

35 Eine Variante des Verfahrens besteht darin, die NH₂-Gruppe der Aminophenylpyridone IA-3 bzw. IA-4 zunächst mit Ammoniumthiocyanat oder einem Alkali- oder Erdalkalithiocyanat in eine Thioharnstoffgruppe (NH-C(S)-NH₂-Gruppe) umzuwandeln und diese anschließend durch Behandlung mit einem Halogen in die Benzothiazole (Verbindungen IC-1a bzw. ID-1 mit R¹⁹ = NH₂) zu überführen.

40

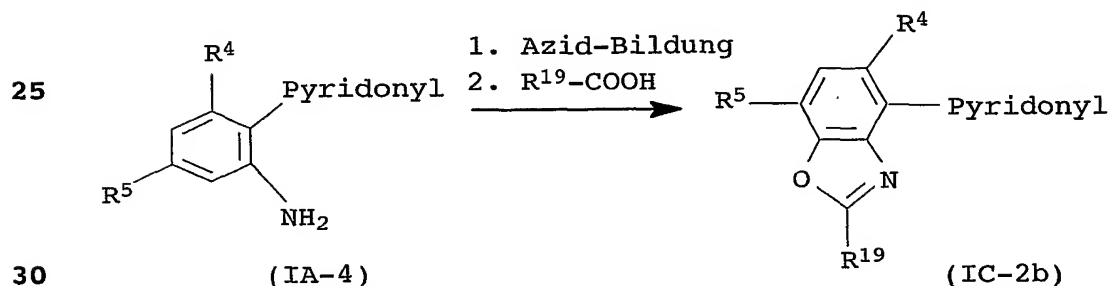
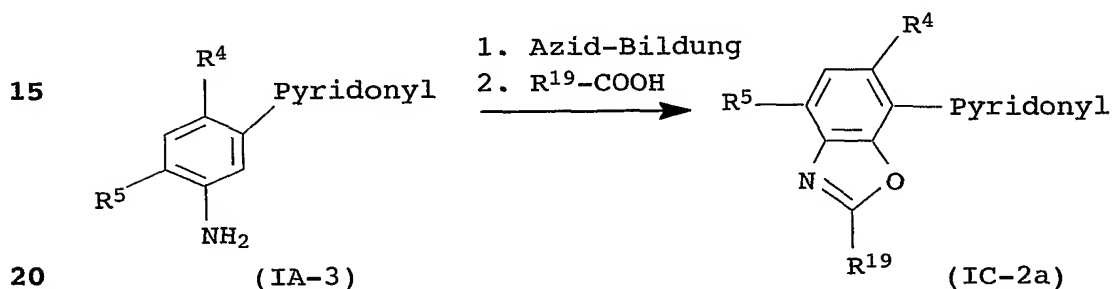
45

80

Schließlich können an der Aminogruppe der Kette $-N=C(NH_2)-S-$ Reaktionen analog zu diejenigen, die bereits unter Abschnitt C.1) beschrieben wurden, durchgeführt werden um auf diese Weise andere Reste R^{19} in die Verbindungen I einzuführen.

5

E.2 Verbindungen der Formel IC, worin R^7 mit $X-R^6$ eine der Ketten $-N=C(R^{19})-O-$ bilden, lassen sich durch sukzessive Umwandlung der NH_2 -Gruppe in den Aminophenylpyridonen der Formel IA-3 bzw. IA-4 in eine Azid-Gruppe (N_3 -Gruppe) und nachfolgende Cyclisierung der dabei erhaltenen Azidophenylpyridone mit einer Carbonsäure zu Verbindungen der Formel IC-2a oder IC-2b herstellen.



Die Umwandlung der Aminogruppe in den Aminophenylpyridonen der Formel IA-3 bzw. IA-4 in eine Azid-Gruppe erfolgt in der Regel zweistufig, d.h. durch Diazotierung der Aminogruppe und nachfolgende Behandlung des dabei erhaltenen Diazoniumsalzes mit einem Azid. Für die Durchführung der Diazotierung gelten die bei Verfahren C.1) gemachten Angaben. Die Überführung in die Arylazide erfolgt vorzugsweise durch Umsetzung von Diazoniumsalze mit einem Alkali- oder Erdalkalimetallazid wie Natriumazid oder durch Umsetzung mit Trimethylsilylazid.

Bei der Umsetzung der Azid-Verbindungen IA ($X-R^6 = N_3$) mit der Carbonsäure $R^{19}-COOH$ arbeitet man entweder in einem inerten organischen Solvens, beispielsweise in Kohlenwasserstoffen wie Toluol oder Hexan, in halogenierten Kohlenwasserstoffen wie Dichlormethan oder Chloroform, in Ethern wie Diethyle-

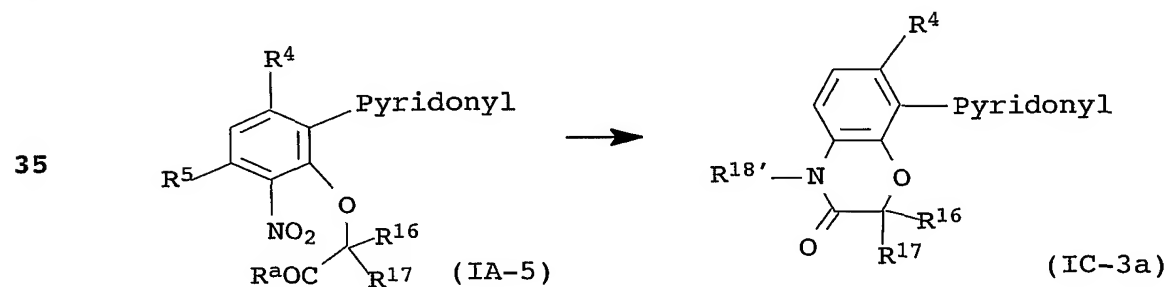
81

ther, Dimethoxyethan, Methyl-t-butylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran, in Amiden wie Dimethylformamid (DMF), Dimethylacetamid (DMA) oder N-Methylpyrrolidon (NMP), in Acetonitril oder vorzugsweise lösungsmittelfrei in einem Überschuss der Carbonsäure $R^{19}COOH$. Im letzteren Fall kann der Zusatz einer Mineralsäure wie Phosphorsäure oder eines silylierenden Reagenzes wie ein Gemisch aus Phosphorpentoxid und Hexamethyldisiloxan hilfreich sein.

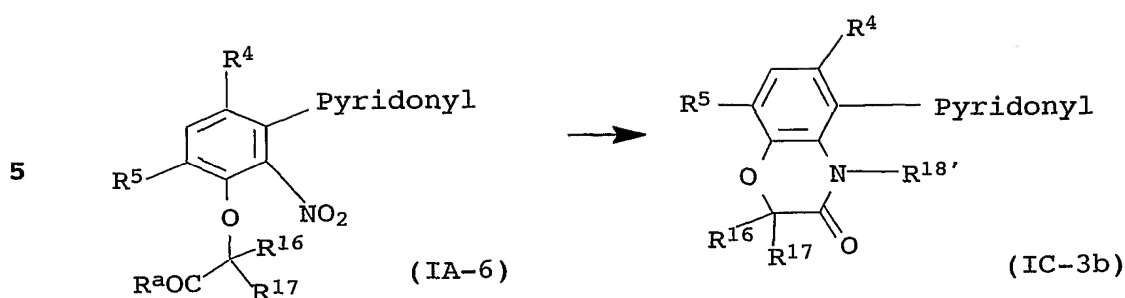
Die Umsetzung wird vorzugsweise bei erhöhter Temperatur, beispielsweise bei der Siedetemperatur des Gemisches, vorgenommen.

F) Die Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin $X-R^6$ mit R^7 eine der Ketten $-O-C(R^{16}, R^{17})-CO-N(R^{18})-$ oder $-S-C(R^{16}, R^{17})-CO-N(R^{18})-$ bildet, kann durch die in den Abschnitten A und B genannten Verfahren erfolgen. Außerdem kann man sie grundsätzlich aus den entsprechenden Aminophenolen oder Mercaptoanilinen IA-1 oder IA-2 nach bekannten Verfahren, beispielsweise nach dem in der US 4,798,620 beschriebenen Verfahren, herstellen. Hinsichtlich dieser Reaktion wird auf die Offenbarung dieser Schrift Bezug genommen.

Insbesondere können solche Verbindungen der Formel I, in denen $X-R^6$ mit R^7 eine Kette $-O-C(R^{16}, R^{17})-CO-N(R^{18})-$ bilden, auch aus den Nitrophenoxyessigsäurederivaten der Formeln IA-5 und IA-6 hergestellt werden. Die Umwandlung gelingt durch Reduktion der Nitrogruppen in IA-5 oder IA-6, wobei in der Regel gleichzeitig mit der Reduktion eine Ringschlussreaktion zu den Verbindungen der Formel IC-3a bzw. IC-3b eintritt.



82



10

In den Formeln IA-5, IA-6, IC-3a und IC-3b haben "Pyridonyl", R⁴, R⁵, R¹⁶ und R¹⁷ die zuvor genannten Bedeutungen. R^{18'} steht für H oder OH. R^a bedeutet eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, z.B. einen C₁-C₄-Alkoxyrest wie Methoxy oder Ethoxy.

15

Die Durchführung dieser Reduktionen kann entsprechend den in Abschnitt C.1) für die Reduktion aromatische Nitrogruppen genannten Bedingungen erfolgen.

20

Die Reaktionsprodukte können gewünschtenfalls durch Alkylierung in weitere Verbindungen der Formel IC-3 überführt werden. Für die Durchführung dieser Reaktionen gilt das unter Abschnitt C.4 Gesagte sinngemäß.

25

Sofern nicht anders angegeben, werden alle vorstehend beschriebenen Verfahren zweckmäßigerweise bei Atmosphärendruck oder unter dem Eigendampfdruck des jeweiligen Reaktionsgemisches vorgenommen.

30

Die Aufarbeitung der Reaktionsgemische erfolgt in der Regel auf an sich bekannte Weise. Sofern nicht bei den vorstehend beschriebenen Verfahren etwas anderes angegeben ist erhält man die Wertprodukte z.B. nach Verdünnen der Reaktionslösung mit Wasser durch Filtration, Kristallisation oder Lösungsmittlextraktion, oder durch Entfernen des Lösungsmittels, Verteilen des Rückstandes in einem Gemisch aus Wasser und einem geeigneten organischen Lösungsmittel und Aufarbeiten der organischen Phase auf das Produkt hin.

40

Die 1-Arylpyridone der Formel I können bei der Herstellung als Isomerengemische anfallen, die jedoch gewünschtenfalls nach den hierfür üblichen Methoden wie Kristallisation oder Chromatographie, auch an einem optisch aktiven Adsorbat, in die weitgehend

reinen Isomeren getrennt werden können. Reine optisch aktive Iso-

83

mere lassen sich vorteilhaft aus entsprechenden optisch aktiven Ausgangsprodukten herstellen.

Landwirtschaftlich brauchbare Salze der Verbindungen I können
5 durch Reaktion mit einer Base des entsprechenden Kations, vorzugsweise einem Alkalimetallhydroxid oder -hydrid, oder durch Reaktion mit einer Säure des entsprechenden Anions, vorzugsweise der Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure oder Salpetersäure, gebildet werden.

10 Salze von I, deren Metallion kein Alkalimetallion ist, können auch durch Umsalzen des entsprechenden Alkalimetallsalzes in üblicher Weise hergestellt werden, ebenso Ammonium-, Phosphonium-, Sulfonium- und Sulfoxoniumsalze mittels Ammoniak, Phosphonium-,
15 Sulfonium- oder Sulfoxoniumhydroxiden.

Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die Verbindungen I oder ihre
20 Salze enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen
25 Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen I bzw. sie enthaltende Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen
30 eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica,
35 Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza
45 sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum,

84

Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera, Zea mays.

- 5 Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Des weiteren eignen sich die 1-Aryl-4-haloalkyl-2-[1H]-pyridone I
10 und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze auch zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen.

Als Desikkantien eignen sie sich insbesondere zur Austrocknung der oberirdischen Teile von Kulturpflanzen wie Kartoffel, Raps,
15 Sonnenblume und Sojabohnen. Auf diese Weise wird ein vollständig mechanisches Beernten dieser wichtigen Kulturpflanzen ermöglicht.

Von wirtschaftlichem Interesse ist auch das zeitlich kontrollierte Abfallen von Früchten oder das Vermindern ihrer Haftfestigkeit an der Pflanze, beispielsweise bei Zitrusfrüchten, Oliven und anderen Sorten von Kern-, Stein- und Schalenobst, da hierdurch die Ernte dieser Früchte erleichtert wird. Das Abfallen beruht auf der Ausbildung von Trenngewebe zwischen Frucht-, Blatt und Sprossenteil der Pflanzen und wird durch die erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel I und ihre Salze gefördert.
25 Die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel I und ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze erlaubt somit ein kontrolliertes Abfallen von Früchten sowie ein kontrolliertes Entblättern von Nutzpflanzen wie Baumwolle (Defoliation) und ermöglicht somit bei derartigen Kulturpflanzen eine Ernteerleichterung. Ein kontrolliertes Entblättern ist insbesondere auch bei Nutzpflanzen wie Baumwolle von Interesse. Durch die Verkürzung des Zeitintervalls, in dem die einzelnen Baumwollpflanzen reif werden, wird eine erhöhte Qualität des geernteten
35 Fasermaterials erzielt.

Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wässrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wässrigen, öligen
40 oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen, Gießen oder Behandlung des Saatgutes bzw. Mischen mit dem Saatgut angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten. Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens ei-

85

ner Verbindung der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsstoffe.

- 5 Als inerte Zusatzstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht: Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, alkylierte Benzole oder deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon oder stark polare Lösungsmittel, z. B. Amine wie N-Methylpyrrolidon oder Wasser.
- 10
- 15 Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die 1-Aryl-4-haloalkyl-2-[1H]-pyridone als solche oder in einem Öl
- 20 oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet
- 25 sind.

- Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalin-
- 30 sulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoetheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.
- 35
- 40

- Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen
- 45 Trägerstoff hergestellt werden.

86

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nusschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

10

Die Konzentrationen der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Die Formulierungen enthalten im allgemeinen 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs. Die

15 Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise wie folgt formuliert werden:

20

I 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. IAe.131 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

30

II 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. IAa.128 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

40

III 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. IAa.10 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen

45

87

Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- IV 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. IAa.95 werden mit 3 Ge-
5 wichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Lignin-sulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Ham-
10 mermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- V 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. IAa.59 werden mit 97 Ge-
15 wichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- VI 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. IAa.22 (Racemat) werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfon-
20 säure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykoether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Disper-
25 sion.
- VII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. IAa.110 wird in einer Mi-
30 schung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- VIII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. IAa.131 wird in einer Mi-
35 schung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol ® EM 31 (nicht ionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl). Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauf-
40 lauf-, im Nachauflaufverfahren oder zusammen mit dem Saatgut einer Kulturpflanze erfolgen. Es besteht auch die Möglichkeit, die herbiziden Mittel bzw. Wirkstoffe dadurch zu applizieren, daß mit den herbiziden Mitteln bzw. Wirkstoffen vorbehandeltes Saatgut einer Kulturpflanze ausgebracht wird. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können
45 Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit

88

nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

- 5 Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0.001 bis 3.0, vorzugsweise 0.01 bis 1.0 kg/ha aktive Substanz (a. S.).

- Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die 1-Aryl-4-haloalkyl-2-[1H]-pyridone mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, (Het)-Aryloxyalkansäure und deren Derivate, Benzoessäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-Aroyl-1,3-cyclohexandione, 2-Hetaroyl-1,3-cyclohexandione, Hetaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, Meta-CF₃-phenylderivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexenonoximether -Derivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- oder Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenylessigsäure und deren Derivate, Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide, Uracile in Betracht.

- Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

40

Die folgenden Beispiele sollen die Erfindung erläutern:

I Herstellbeispiele:

- 45 I.1 1-Aryl-2,6(1H,3H)-dihydropyridindione der allgemeinen Formel IIa

89

1. Herstellung von (2E)-3-Trifluormethyl-2-pentendicarbonsäure-diethylester (Vorstufe a)

5 Zur einer Lösung von 150 g (431 mmol) Triphenylphosphoranylidenessigsäureethylester in 500 ml Diethylether gab man innerhalb einer Stunde 79,3 g (431 mmol) Trifluoracetessigsäureethylester und beließ die Mischung über Nacht bei Raumtemperatur. Man filtrierte den entstandenen Niederschlag ab und engte das Filtrat im Vakuum ein. Auf diese Weise erhielt man 10 119 g der Vorstufe a, die laut $^1\text{H-NMR}$ noch mit Triphenylphosphinoxid verunreinigt war. Das Rohprodukt wurde ohne weitere Reinigung in den folgenden Stufen eingesetzt.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 270 MHz) δ [ppm]: 1,3 (2t, 6H), 3,75 (s, 2H), 4,2 (2q, 4H), 6,55 (s, 1H), 7,4-7,7 (Triphenylphosphinoxid).

15

2. Herstellung von (2E)-3-Trifluormethyl-2-pentendicarbonsäure

Zu einer Lösung von 119 g (etwa 431 mmol) der Vorstufe a in 1 l Ethanol gab man innerhalb 20 Minuten bei Raumtemperatur eine Lösung von 37,9 g (948 mmol) Natriumhydroxid in 200 ml Wasser und rührte über Nacht bei Raumtemperatur nach. Nach 20 Einengen der Reaktionsmischung im Vakuum verteilte man zwischen 300 ml Wasser und 300 ml Ethylacetat, trennte die Phasen und säuerte die wässrige Phase mit konzentrierter Salzsäure auf pH 1 an. Man extrahierte dreimal mit Ethylacetat, 25 trocknete die vereinigten organischen Phasen über Magnesiumsulfat und engte die organische Phase im Vakuum ein. Man erhielt auf diese Weise 78,9 g der Dicarbonsäure (Vorstufe b) als farblosen Feststoff.

30 $^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO, 400 MHz) δ [ppm]: 3,6 (s, 2H), 6,55 (s, 1H).

3. Herstellung von (2E)-3-Methyl- und (2E)-4-Methyl-3-trifluormethyl-2-pentendicarbonsäure

35 Ausgehend von Triphenylphosphoranylidenessigsäureethylester und 2-(Trifluoracetyl)propionsäureethylester erhielt man nach Umsetzung gemäß der für die Vorstufen a und b angegebenen Methoden (2E)-2-Methyl-3-trifluormethylpentendicarbonsäure und (2E)-4-Methyl-3-trifluormethyl-2-pentendicarbonsäure als Iso- 40 merengemisch im Mol-Verhältnis 1:2. Das Isomerengemisch wurde zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel II ohne weitere Reinigung eingesetzt (Vorstufe c).

4. Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel II

45

90

2-Chlor-5-(2,6-dioxo-4-(trifluormethyl)-3,6-dihydro-1(2H)-pyridinyl)-4-fluorbenzoesäureisopropylester (Vorprodukt 1)

Methode A

5

2,0 g (10 mmol) Vorstufe b und 2,3 g (10 mmol) 5-Amino-2-chlor-4-fluorbenzoesäureisopropylester wurden 1,5 h auf 160 °C erhitzt. Nach dem Abkühlen erhielt man 3,7 g des Vorprodukts 1 (siehe Tabelle 3), was einer Ausbeute von 94 % der Theorie entspricht.

10

Methode B

15

2,0 g (10 mmol) Vorstufe b und 2,3 g (10 mmol) 5-Amino-2-chlor-4-fluorbenzoesäureisopropylester wurden in 40 ml Dichlormethan gelöst. Man entfernte das Lösungsmittel im Vakuum. Das so erhaltene Substanzgemisch wurde dann 1 h bei 700 W und 2 h bei 1000 W in einer handelsüblichen Mikrowelle erhitzt. Man erhielt die Titelverbindung in quantitativer Ausbeute.

20

In analoger Weise wurden die in Tabelle 3 angegebenen Vorprodukte 2 bis 20 hergestellt, wobei zur Herstellung der Verbindungen 14 bis 20 die Vorstufe c anstelle der Vorstufe b eingesetzt wurde. Es wurde jeweils nur 1 Isomer erhalten.

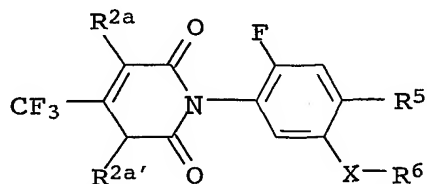
25

Die Herstellung von Vorprodukt 4 erfolgte nach einer modifizierten Methode B, bei der man die Vorstufe b und das O-Ethylloxim des 5-Amino-2-chlor-4-fluorbenzaldehyds in Xylol 90 Minuten bei 1000 W umgesetzt hat.

30

Tabelle 3: Verbindungen der allgemeinen Formel II mit $R^3 = CF_3$ und $R^4 = F$; Vorprodukte 1 bis 20.

35



(IIa)

40

45

91

	Vor- pro- dukt	R ⁵	R ^{2a}	R ^{2a'}	X-R ⁶	¹ H-NMR δ [ppm], CDCl ₃ , 270 MHz bzw. 400 MHz
5	1	Cl	H	H	COO-CH(CH ₃) ₂	δ 1,4 (6H), 3,8 (2H), 5,25 (1H), 6,8 (1H), 7,4 (1H), 7,8 (1H)
10	2	Cl	H	H	CH=C(Cl)-CO ₂ C ₂ H ₅	δ 1,4 (3H), 3,8 (2H), 4,4 (2H), 6,8 (sH), 7,4 (1H), 7,9 (1H), 8,1 (1H)
15	3	Cl	H	H	O-CH ₂ -C≡CH	δ 2,6 (1H), 3,75 (2H), 4,7 (2H), 6,8 (1H), 6,9 (1H), 7,3 (1H)
20	4	Cl	H	H	CH=N-OC ₂ H ₅	δ 1,3 (3H), 3,75 (2H), 4,2 (2H), 6,8 (sH), 7,3 (1H), 7,8 (1H), 8,4 (1H)
	5	CN	H	H	O-CH ₂ -C≡CH	δ 2,6 (1H), 3,75 (2H), 4,8 (2H), 6,8 (1H), 7,0 (1H), 7,5 (1H)
25	6	Cl	H	H	COO-cyclo-C ₅ H ₉	
	7	Cl	H	H	COO-CH(CH ₃)-CO ₂ CH ₃ S-Enantiomer	
	8	Cl	H	H	COO-CH ₂ -C≡CH	
	9	Cl	H	H	COO-CH ₂ -CH=CH ₂	
30	10	Cl	H	H	O-cyclo-C ₅ H ₉	
	11	Cl	H	H	O-CH ₃	
	12	CN	H	H	O-CH ₃	
	13	Cl	H	H	O-CH(CH ₃)-CO ₂ CH ₃ Racemat	
35	14	Cl	CH ₃	H	COO-CH(CH ₃) ₂	
	15	Cl	CH ₃	H	O-CH ₂ -C≡CH	
	16	Cl	CH ₃	H	CH=N-OC ₂ H ₅	
	17	Cl	CH ₃	H	O-CH(CH ₃)-CO ₂ CH ₃ Racemat	
	18	Cl	CH ₃	H	CH=C(Cl)-CO ₂ C ₂ H ₅	
	19	Cl	CH ₃	H	COO-CH ₂ -CH=CH ₂	
40	20	Cl	CH ₃	H	COO-CH(CH ₃)-CO ₂ CH ₃ S-Enantiomer	

I.2 1-Aryl-2-(1H)-4-trifluormethyl-6-chlorpyridone (Beispiele 1 bis 21)

45 2-Chlor-5-[2-chlor-6-oxo-4-(trifluormethyl)-1-(6H)-pyridinyl]-4-fluorbenzoesäureisopropylester (Beispiel 1)

92

- 2,3 g (5,8 mmol) 2-Chlor-5-[2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-1-(2H)-pyrindinyl]-4-fluorbenzoesäureisopropylester (Vorprodukt 1) wurden in 10 ml Phosphoroxitrichlorid (POCl₃) 6 h zum Rückfluss erhitzt. Man ließ über Nacht abkühlen, entfernte überschüssiges Phosphoroxitrichlorid im Vakuum und reinigte das Rohprodukt durch Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan/Ethylacetat). Man erhielt auf diese Weise 1,1 g der Titelverbindung in einer Ausbeute von 46 %.
- 10 In analoger Weise stellte man aus den Vorprodukten 2 - 20 die Verbindungen der Beispiele 2 - 21 (siehe Tabelle 4) her.

I.3 1-Aryl-2-(1H)-4-trifluormethylpyridone (Beispiele 22 bis 26)

15 Beispiel 22

2,5-Difluor-4-[2-oxo-4-(trifluormethyl)-1-(2H)-pyridinyl]-benzonitril

- 20 Zu einer Lösung von 8,1 g (50 mmol) 4-(Trifluormethyl)-2-pyridon in 100 ml Dimethylformamid gab man 7,6 g (55,5 mmol) Kaliumcarbonat. Hierzu gab man anschließend bei Raumtemperatur eine Lösung von 8,6 g (55 mmol) 2,4,5-Trifluorbenzonitril in 10 ml Dimethylformamid. Man erwärmte insgesamt 13 h auf
- 25 80 °C. Nach dem Abkühlen engte man die Reaktionsmischung in Vakuum ein, löste den Rückstand in 400 ml Methyl-tert.-butylether, wusch die organische Phase zweimal mit Wasser, trocknete die organische Phase über Magnesiumsulfat und engte sie im Vakuum ein. Das hierbei erhaltene Rohprodukt reinigte man
- 30 durch Chromatographie an Kieselgel mit einem Cyclohexan/Essigestergradienten (4:1 bis 1:2). Man erhielt auf diese Weise 9,6 g der Titelverbindung mit einem Schmelzpunkt von 150 °C. Die ¹H-NMR-Daten der Verbindung sind in Tabelle 4 angegeben.

35 Beispiel 23

5-Fluor-2-methoxy-4-[2-oxo-4-(trifluormethyl)-1-(2H)-pyridinyl]-benzonitril

- 40 0,6 g (2 mmol) der Verbindung aus Beispiel 22 löste man in 60 ml Methanol und gab hierzu 0,36 g (2,0 mmol) einer 30 gew.-%igen Natriummethylat-Lösung. Man rührte die Mischung über Nacht bei Raumtemperatur und engte dann die Reaktionsmischung im Vakuum zur Trockne ein. Der Rückstand wurde durch
- 45 Chromatographie an Kieselgel (MPLC) mit Cyclohexan/Ethylacetat (4:1) als Eluent gereinigt. Man erhielt 0,4 g (64 % der Theorie) der Titelverbindung mit einem Schmelzpunkt von

93

194 - 196 °C. Das ¹H-NMR-Spektrum der Verbindung ist in Tabelle 4 angegeben.

Beispiel 24

5

5-Fluor-4-[2-oxo-4-(trifluormethyl)-1-(2H)-pyridinyl]-2-(2-propinyloxy)-benzonitril

10

Zu einer Lösung von 0,2 g (3,5 mmol) Propargylalkohol in 50 ml Tetrahydrofuran gab man 0,16 g (4,0 mmol) Natriumhydrid (60 % in Weißöl). Man rührte 10 Minuten bei Raumtemperatur und gab dann hierzu eine Lösung von 1,0 g (3,3 mmol) der Verbindung aus Beispiel 22 in 20 ml Tetrahydrofuran innerhalb von 10 Minuten. Man behielt die Mischung über Nacht bei Raumtemperatur und erhitze sie dann 30 Minuten zum Rückfluss. Nach dem Abkühlen engte man die Reaktionsmischung in Vakuum ein und reinigte den Rückstand durch Chromatographie an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester als Gradienten. Man erhielt auf diese Weise 0,9 g der leicht verunreinigten Titelverbindung. Die Abtrennung der Verunreinigungen erfolgte mittels MPLC.

15

20

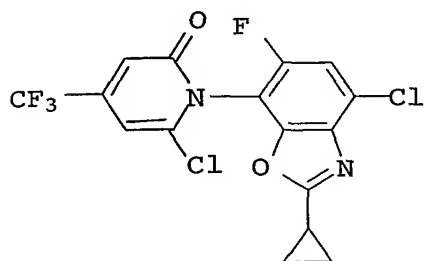
In analoger Weise wurden die Verbindungen der Beispiele 25 und 26 hergestellt.

25

Beispiel 27

4-Chlor-6-fluor-7-[2-chlor-6-oxo-4-trifluormethyl-1-(6H)-pyridinyl]-2-cyclopropyl-1,3-benzoxazol (Verbindung ICa.15)

30



35

40

27.1 4-Chlor-6-fluor-7-[2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-1-(2H)-pyridinyl]-2-cyclopropyl-1,3-benzoxazol

Ausgehend von 7-Amino-4-chlor-6-fluor-2-cyclopropyl-1,3-benzoxazol und (2E)-3-Trifluormethyl-2-pentendicarbonsäure erhielt man nach Methode A die Vorstufe

45

4-Chlor-6-fluor-7-[2,6-dioxo-4-trifluormethyl-3,6-dihydro-1-(2H)-pyridinyl]-2-cyclopropyl-1,3-benzoxazol, die ohne

94

weitere Reinigung in der anschließenden Umsetzung eingesetzt wurde.

5 27.2 4-Chlor-6-fluor-7-[2-chlor-6-oxo-4-trifluormethyl-1-(6H)-pyridinyl]-2-cyclopropyl-1,3-benzoxazol

Auf die im Beispiel 1 beschriebene Weise wurde die Titelverbindung ausgehend von der Verbindung aus Beispiel 27.1 und Phosphoroxitrichlorid erhalten.

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1,2-1,4 (m, 4H, cPr), 2,2 (m, 1H, cPr), 6,6 (s, 1H, Pyridon-H), 6,95 (s, 1H, Pyridon-H), 7,3 (d, 1H, Ar-H).

15

20

25

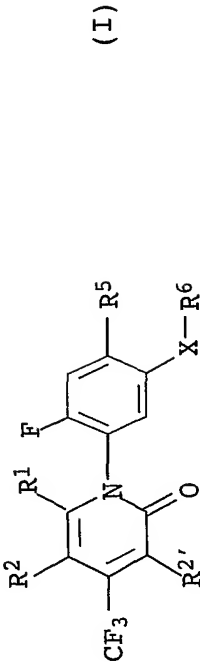
30

35

40

45

Tabelle 4: Verbindungen der allgemeinen Formel IAa mit R³ = CF₃ und R⁴ = F; Beispiele 1 bis 26.



Bsp.	Nr. 1)	R ¹	R ²	R ^{2'}	R ⁵	X-R ⁶	¹ H-NMR (CDCl ₃ ; 270 bzw. 400 MHz)
1	IAa.59	Cl	H	H	Cl	COO-CH(CH ₃) ₂	δ 1.45 (d, 6H, CH(CH ₃) ₂), 5.3 [septett, 1H, CH(CH ₃) ₂], 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.45 (d, 1H, Ar-H), 7.85 (d, 1H, Ar-H)
2 2)	IAa.95	Cl	H	H	Cl	CH=C(Cl)-CO ₂ C ₂ H ₅	δ 1.4 (t, 3H, CH ₂ CH ₃), 4.4 (q, 2H, CH ₂ CH ₃), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.45 (d, 1H, Ar-H), 7.95 (d, 1H, Ar-H), 8.1 [s, 1H, CH=C(Cl)COOEt]
3	IAa.10	Cl	H	H	Cl	O-CH ₂ -C≡CH	δ 2.6 (t, 1H, C≡CH), 4.8 (d, 2H, OC-H ₂ C≡C), 6.55 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.0 (d, 1H, Ar-H), 7.4 (d, 1H, Ar-H)
4	IAa.110	Cl	H	H	Cl	CH=N-OC ₂ H ₅	δ 1.3 (t, 3H, CH ₂ CH ₃), 4.2 (q, 2H, CH ₂ CH ₃), 6.55 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.35 (d, 1H, Ar-H), 7.85 (d, 1H, Ar-H), 8.4 (s, 1H, CH=N-NOEt)

Bsp.	Nr. 1)	R ¹	R ²	R ^{2'}	R ⁵	X-R ⁶	¹ H-NMR (CDCl ₃ ; 270 bzw. 400 MHz)
5	IAa.131	Cl	H	H	CN	O-CH ₂ -C≡CH	δ 2.6 (t, 1H, C≡CH), 4.8, 4.9 (2dd, zus. 2H, OCH ₂ C≡C), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.1 (d, 1H, Ar-H), 7.55 (d, 1H, Ar-H)
6	IAa.62	Cl	H	H	Cl	COO-Cyclopentyl	δ 1.6 – 2.0 (m, 8H, Cyclopentyl), 5.4 (m, 1H, OCH), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.4 (d, 1H, Ar-H), 7.8 (d, 1H, Ar-H)
7 4)	IAa.769	Cl	H	H	Cl	COO-CH(CH ₃)-CO ₂ CH ₃ S-Enantiomer, Rotationsisomergemisch	δ 1.6 (d, 3H, CHCH ₃), 3.8 (s, 3H, OMe), 5.35 (q, 1H, OCHCH ₃), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.45 (d, 1H, Ar-H), 8.0 (d, 1H, Ar-H)
8	IAa.61	Cl	H	H	Cl	COO-CH ₂ -C≡CH	δ 2.55 (t, 1H, C≡CH), 4.95 (d, 2H, COOCH ₂), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.45 (d, 1H, Ar-H), 7.95 (d, 1H, Ar-H)
9	IAa.60	Cl	H	H	Cl	COO-CH ₂ -CH=CH ₂	δ 4.8 (d, 2H, COOCH ₂), 5.35, 5.45 (2d, zus. 2H, Allyl-H), 6.0 (m, 1H, Allyl-H), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.45 (d, 1H, Ar-H), 7.95 (d, 1H, Ar-H)
10	IAa.12	Cl	H	H	Cl	O-Cyclopentyl	δ 1.6 – 2.0 (m, 8H, Cyclopentyl), 4.75 (m, 1H, OCH), 6.55 (s, 1H, Pyridon-H), 6.75 (d, 1H, Ar-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.35 (d, 1H, Ar-H)

Bsp.	Nr. 1)	R ¹	R ²	R ^{2'}	R ⁵	X-R ⁶	¹ H-NMR (CDCl ₃ ; 270 bzw. 400 MHz)
11	IAa.7	Cl	H	H	Cl	O-CH ₃	δ 3.9 (s, 3H, OMe), 6.55 (s, 1H, Pyridon-H), 6.8 (d, 1H, Ar-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.35 (d, 1H, Ar-H), Schmp. 162-163 °C
12	IAa.128	Cl	H	H	CN	O-CH ₃	δ 3.95 (s, 3H, OMe), 6.55 (s, 1H, Pyridon-H), 6.9 (d, 1H, Ar-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.55 (d, 1H, Ar-H) Schmp. 191-196 °C
13 4)	IAa.22	Cl	H	H	Cl	O-CH(CH ₃)-CO ₂ CH ₃ Racemat, Rotationsisomerenmischung	δ 1.7 (d, 3H, CHCH ₃), 3.75 (s, 3H, COOMe), 4.7 (q, 1H, CHCH ₃), 6.55 (s, 1H, Pyridon-H), 6.75 (Isomer A) bzw. 6.8 (Isomer B) (d, 1H, Ar-H), 6.9 (s, 1H, Pyridon-H), 7.4 (d, 1H, Ar-H)
14	IAb.59	Cl	H	CH ₃	Cl	COO-CH(CH ₃) ₂	δ 1.4 (d, 6H, CH(CH ₃) ₂), 2.3 (s, 3H, CH ₃ , Pyridon), 5.25 [septett, 1H, CH(CH ₃) ₂], 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 7.4 (d, 1H, Ar-H), 7.8 (d, 1H, Ar-H)
15	IAb.10	Cl	H	CH ₃	Cl	O-CH ₂ -C≡CH	δ 2.3 (s, 3H, CH ₃ , Pyridon), 2.6 (t, 1H, C≡CH), 4.8 (d, 2H, OCH ₂ C≡C), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 7.0 (d, 1H, Ar-H), 7.4 (d, 1H, Ar-H); Schmelzpunkt 91-92°C
16	IAb.110	Cl	H	CH ₃	Cl	CH=N-OC ₂ H ₅	δ 1.3 (t, 3H, CH ₂ CH ₃), 2.3 (s, 3H, CH ₃ , Pyridon), 4.2 (q, 2H, CH ₂ CH ₃), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 7.35 (d, 1H, Ar-H), 7.85 (d, 1H, Ar-H), 8.4 (s, 1H, CH=NOEt)

Bsp.	Nr. 1)	R ¹	R ²	R ^{2'}	R ⁵	X-R ⁶	¹ H-NMR (CDCl ₃ ; 270 bzw. 400 MHz)
17 4)	IAb.22	Cl	H	CH ₃	Cl	O-CH(CH ₃)-CO ₂ CH ₃ Racemat, Rotationsisomerenmischung	δ 1.7 (d, 3H, CHCH ₃), 2.3 (s, 3H, CH ₃ , Pyridon), 3.75 (s, 3H, COOMe), 4.7 (q, 1H, CHCH ₃), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 6.75 (isomer A) bzw. 6.85 (isomer B) (d, 1H, Ar-H), 7.35 (d, 1H, Ar-H)
18 2)	IAb.95	Cl	H	CH ₃	Cl	CH=C(Cl)-CO ₂ C ₂ H ₅	δ 1.4 (t, 3H, CH ₂ CH ₃), 2.3 (s, 3H, CH ₃ , Pyridon), 4.4 (q, 2H, CH ₂ CH ₃), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 7.4 (d, 1H, Ar-H), 7.95 (d, 1H, Ar-H), 8.1 [s, 1H, CH=C(Cl)COOEt]
19 2) 3)	IAC.95	Cl	CH ₃	H	Cl	CH=C(Cl)-CO ₂ C ₂ H ₅	δ 1.4 (t, 3H, CH ₂ CH ₃), 2.3 (s, 3H, CH ₃ , Pyridon), 4.4 (q, 2H, CH ₂ CH ₃), 7.0 (s, 1H, Pyridon-H), 7.4 (d, 1H, Ar-H), 7.9 (d, 1H, Ar-H), 8.1 [s, 1H, CH=C(Cl)COOEt]
20	IAb.60	Cl	H	CH ₃	Cl	COO-CH ₂ -CH=CH ₂	δ 2.3 (s, 3H, CH ₃ , Pyridon), 4.8 (d, 2H, COOCH ₂), 5.35, 5.45 (2d, zus. 2H, Allyl-H), 6.0 (m, 1H, Allyl-H), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 7.4 (d, 1H, Ar-H), 7.9 (d, 1H, Ar-H)
21 4)	IAb.769	Cl	H	CH ₃	Cl	COO-CH(CH ₃)-CO ₂ CH ₃ S-Enantiomer, Rotationsisomerenmischung	δ 1.6 (d, 3H, CHCH ₃), 2.3 (s, 3H, CH ₃ , Pyridon), 3.8 (s, 3H, OMe), 5.35 (q, 1H, OCHCH ₃), 6.6 (s, 1H, Pyridon-H), 7.45 (d, 1H, Ar-H), 8.0 (d, 1H, Ar-H)
22	IAe.123	H	H	H	CN	F	δ 6.45 (d, 1H), 7.0 (s, 1H), 7.3-7.4 (m, 2H), 7.6 (dd, 1H); Schmelzpunkt 150°C
23	IAe.128	H	H	H	CN	OCH ₃	δ 3.95 (s, 3H, OMe), 6.45 (d, 1H), 7.0 (s, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.4 (d, 1H), 7.5 (d, 1H); Schmelzpunkt 194-196°C

Bsp.	Nr. 1)	R ¹	R ²	R ^{2'}	R ⁵	X-R ⁶	¹ H-NMR (CDCl ₃ ; 270 bzw. 400 MHz)
24	IAe.131	H	H	H	CN	O-CH ₂ -C≡CH	δ 2.6 (t, 1H, C≡CH), 4.85 (d, 2H, OCH ₂ C≡C), 6.45 (dd, 1H), 7.0 (s, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.4 (d, 1H), 7.55 (d, 1H)
25	IAe.132	H	H	H	CN	O-CH(CH ₃)-C≡CH	δ 1.8 (d, 3H, OCH(CH ₃)-C≡CH), 2.6 (d, 1H, C≡CH), 4.9 (dq, 1H, OCH(Me)C≡CH), 6.45 (dd, 1H), 7.0 (s, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.5 (d, 1H); Schmelzpunkt 176-181°C
26	IAe.143	H	H	H	CN	O-CH(CH ₃)-CO ₂ CH ₃ Racemat	δ 1.75 (d, 3H, OCH(CH ₃)COOMe), 3.8 (s, 3H, COOCH ₃), 4.8 (q, 1H, OCH(CH ₃)COOMe), 6.45 (dd, 1H), 6.9 (d, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.3 (d, 1H), 7.55 (d, 1H); Schmelzpunkt 131-133°C

1) Nummerierung gemäß Tabelle 1

2) Z-Enantiomer (Phenylring bezogen auf Halogenatom)

3) Nebenprodukt bei der Herstellung von Ib.95 (Beispiel 18)

4) Diastereomergemisch (Beispiele 7, 13, 17, 21)

II Anwendungsbeispiele

Die herbizide Wirkung der 1-Aryl-4-haloalkyl-2-[1H]-pyridone der Formel I ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastiktöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

10

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

20 Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden
25 erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 0.0313 und 0.0156 kg a. S./ha.

Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 - 25°C
30 bzw. 20 - 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

35 Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

40 Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

101

5	Bayercode	Deutscher Name	Englischer Name
	ABUTH	Chinesischer Hanf	velvet leaf
	AMARE	Zurückgekrümmter Fuchsschwanz	redroot pigweed
	COMBE	Bengalische Commeline	dayflower
	GALAP	Klettenlabkraut	catchweed bedstraw
	SETFA	Borstenhirse	giant foxtail

- 10 Die Verbindung aus Beispiel 1 (Nr. IAa.59) zeigte dabei sehr gute Wirkung gegen die genannten Schadpflanzen.

Anwendungsbeispiele (desikkant/defoliantische Wirksamkeit)

- 15 Als Testpflanzen dienten junge, 4-blättrige (ohne Keimblätter) Baumwollpflanzen, die unter Gewächshausbedingungen angezogen wurden (rel. Luftfeuchtigkeit 50 bis 70 %; Tag-/Nachttemperatur 27/20°C).
- 20 Die jungen Baumwollpflanzen wurden tropfnass mit wässrigen Aufbereitungen der Wirkstoffe (unter Zusatz von 0,15 Gew.-% des Fetalkoholalkoxylats Plurafac ® LF 700, bezogen auf die Spritzbrühe) blattbehandelt. Die ausgebrachte Wassermenge betrug umgerechnet 1000 l/ha. Nach 13 Tagen wurde die Anzahl der abgeworfenen Blätter und der Grad der Entblätterung in % bestimmt.
- 25

Bei den unbehandelten Kontrollpflanzen trat kein Blattbefall auf.

30

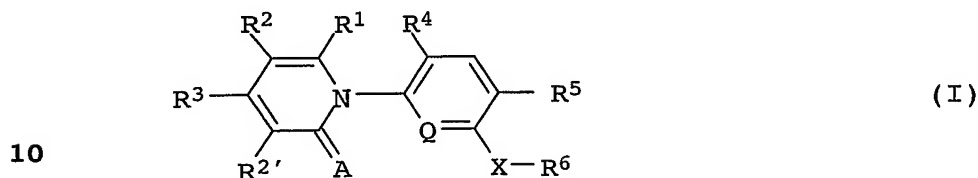
35

40

45

Patentansprüche

1. Verwendung von 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridonen der
5 allgemeinen Formel I



- 15 worin die Variablen A, X, Q, R¹, R², R^{2'}, R³, R⁴, R⁵ und R⁶ folgende Bedeutung haben:

- R¹ Wasserstoff oder Halogen;
- 20 R² und R^{2'} unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino oder C₁-C₄-Alkyl;
- R³ C₁-C₄-Halogenalkyl;
- R⁴ Wasserstoff oder Halogen;
- 25 R⁵ Wasserstoff, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkoxy;
- A Sauerstoff oder Schwefel;
- 30 X eine chemische Bindung, Methylen, 1,2-Ethylen, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,2-diyl, Ethin-1,2-diyl oder über das Heteroatom an den Phenylring gebundenes Oxymethylen oder Thiamethylen, wobei alle Gruppen unsubstituiert sein
- 35 oder einen oder zwei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, Di-(C₁-C₄-Alkyl)amino und Phenyl;
- 40 R⁶ Wasserstoff, Nitro, Cyano, Halogen, Halogensulfonyl, -O-Y-R⁸, -O-CO-Y-R⁸, -N(Y-R⁸)(Z-R⁹), -N(Y-R⁸)-SO₂-Z-R⁹, -N(SO₂-Y-R⁸)(SO₂-Z-R⁹), -N(Y-R⁸)-CO-Z-R⁹, -N(Y-R⁸)(O-Z-R⁹), -S(O)_n-Y-R⁸, mit n = 0, 1 oder 2, -SO₂-O-Y-R⁸, -SO₂-N(Y-R⁸)(Z-R⁹), -CO-Y-R⁸, -C(=NOR¹⁰)-Y-R⁸,
- 45 -C(=NOR¹⁰)-O-Y-R⁸, -CO-O-Y-R⁸, -CO-S-Y-R⁸, -CO-N(Y-R⁸)(Z-R⁹), -CO-N(Y-R⁸)(O-Z-R⁹) oder -PO(O-Y-R⁸)₂;

103

Q Stickstoff oder eine Gruppe C-R⁷, worin R⁷ für Wasserstoff, OH, SH oder NH₂ steht; oder

5 X-R⁶ und R⁷ eine 3- oder 4-gliedrige Kette, deren Kettenglieder neben Kohlenstoff 1, 2 oder 3 Heteroatome, ausgewählt unter Stickstoff-, Sauerstoff- und Schwefelatomen, aufweisen können, die unsubstituiert sein oder ihrerseits einen, zwei oder drei Substituenten tragen kann, und
 10 deren Glieder auch ein oder zwei nicht benachbarte Carbonyl-, Thiocarbonyl- oder Sulfonyl-Gruppen umfassen können,

worin die Variablen Y, Z, R⁸, R⁹ und R¹⁰ die nachfolgend angegebenen Bedeutungen haben:

15

Y, Z unabhängig voneinander:

eine chemische Bindung, Methylen oder 1,2-Ethylen, die unsubstituiert sein oder einen oder zwei Substituenten tragen können, jeweils ausgewählt aus der Gruppe
 20 bestehend aus Carboxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl und Phenyl;

R⁸, R⁹ unabhängig voneinander:

Wasserstoff, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl,
 25 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, -CH(R¹¹)(R¹²), -C(R¹¹)(R¹²)-NO₂, -C(R¹¹)(R¹²)-CN, -C(R¹¹)(R¹²)-Halogen, -C(R¹¹)(R¹²)-OR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-N(R¹³)R¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-N(R¹³)-OR¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-SR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-SO-R¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-SO₂-R¹³,
 30 -C(R¹¹)(R¹²)-SO₂-OR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-SO₂-N(R¹³)R¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-R¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-C(=NOR¹⁵)-R¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-OR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-SR¹³, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-N(R¹³)R¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-CO-N(R¹³)-OR¹⁴, -C(R¹¹)(R¹²)-PO(OR¹³)₂, C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl,
 35 C₃-C₈-Cycloalkyl, das ein Carbonyl- oder Thiocarbonyl-Ringglied enthalten kann, Phenyl oder 3-, 4-, 5-, 6- oder 7-gliedriges Heterocyclyl, das ein Carbonyl- oder Thiocarbonyl-Ringglied enthalten kann,
 40 wobei jeder Cycloalkyl-, der Phenyl- und jeder Heterocyclyl-Ring unsubstituiert sein oder ein, zwei, drei oder vier Substituenten tragen kann, jeweils ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl,
 45 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl,

104

(C₁-C₄-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl,
 (C₁-C₄-Alkyl)carbonyloxy, (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyloxy,
 (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl und Di-(C₁-C₄-Alkyl)amino;

- 5 R¹⁰ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
 C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl,
 C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl,
 C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkyl;
- 10 wobei die Variablen R¹¹ bis R¹⁵ die folgenden Bedeutungen auf-
 weisen:
- R¹¹, R¹² unabhängig voneinander
 Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl,
 (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₄-alkyl oder
 Phenyl-C₁-C₄-alkyl, wobei der Phenylring unsubstituiert
 sein oder ein bis drei Substituenten tragen, jeweils
 ausgewählt aus der Gruppe bestehend aus Cyano, Nitro,
 Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl und
 (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl;
- R¹³, R¹⁴ unabhängig voneinander
 Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alk-
 oxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl,
 C₂-C₆-Alkinyl, C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₈-Cycloalkyl,
 C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl,
 3- bis 7-gliedriges Heterocyclyl oder
 Heterocyclyl-C₁-C₄-alkyl, wobei jeder Cycloalkyl- und
 jeder Heterocyclyl-Ring ein Carbonyl- oder
 Thiocarbonyl-Ringglied enthalten kann,
 und wobei jeder Cycloalkyl-, der Phenyl- und jeder
 Heterocyclyl-Ring unsubstituiert sein oder ein bis vier
 Substituenten tragen kann, jeweils ausgewählt aus der
 Gruppe bestehend aus Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy,
 Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio,
 C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl,
 C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, (C₁-C₄-Alkyl)carbonyl,
 (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkyl)carbonyloxy,
 (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyloxy, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl
 und Di-(C₁-C₄-Alkyl)amino;

105

R¹⁵ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl,
C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl oder
Phenyl-C₁-C₄-alkyl;

5

und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salzen als Herbizide
oder zur Desikkation/Defoliation von Pflanzen.

2. 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone der in Anspruch 1 defi-
nierten Formel I, worin die Variablen A, X, Q, R¹, R², R^{2'},
R³, R⁴, R⁵ und R⁶ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung ha-
ben;

- ausgenommen solche Verbindungen der Formel I, worin A für
Sauerstoff, Q für CH, R³ und R⁵ für Trifluormethyl stehen, und
R¹, R², R^{2'}, R⁴ und X-R⁶ Wasserstoff bedeuten; oder worin A
für Sauerstoff und Q für N stehen, R³ und R⁴ die in Anspruch 1
genannten Bedeutungen aufweisen, R¹, R² und R^{2'} Wasserstoff
bedeuten und X-R⁶ für Wasserstoff oder Halogen steht, wenn R⁵
Trifluormethyl bedeutet;

- weiterhin ausgenommen Verbindungen der Formel I, worin A für
Sauerstoff, Q für CH und R³ für Trifluormethyl stehen, R⁵ die
in Anspruch 1 genannte Bedeutung hat, R¹, R², R^{2'}, R⁴
Wasserstoff bedeuten und X-R⁶ für eine Gruppe S(O)_n-Y-R⁸ mit
n = 0, 1 oder 2 steht, worin Y eine Einfachbindung bedeutet
und R⁸ ausgewählt ist unter n-Propyl, Isopropyl,
Cyclopropylmethyl und 2,2,2-Trifluorethyl;

- und deren landwirtschaftlich brauchbare Salze.

3. 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone nach Anspruch 2 der
allgemeinen Formel I, worin Q für Stickstoff oder CH steht.

4. 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone nach Anspruch 2 der
allgemeinen Formel I, worin Q für C-R⁷ steht und R⁷ zusammen
mit -X-R⁶ für eine Kette der Formeln: -O-C(R¹⁶, R¹⁷)-CO-N(R¹⁸)-,
-S-C(R¹⁶, R¹⁷)-CO-N(R¹⁸)-, -N=C(R¹⁹)-O- und -N=C(R¹⁹)-S- stehen,
in der die Variablen R¹⁶ bis R¹⁹ die folgenden Bedeutungen ha-
ben:

R¹⁶, R¹⁷ unabhängig voneinander
Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl,
C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl,
C₂-C₆-Halogenalkinyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl oder
Phenyl-C₁-C₄-alkyl;

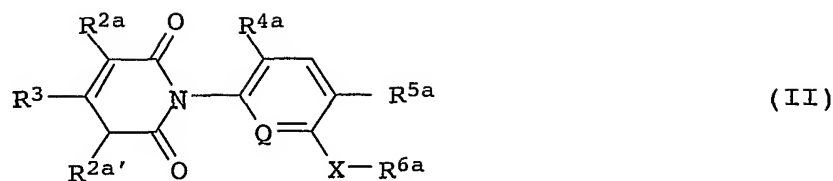
106

- R¹⁸** Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Halogenalkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 3-, 4-, 5-, 6- oder 7-gliedriges Heterocyclyl, das ein oder zwei Ring-Heteroatome, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, aufweist,
- R¹⁹** Wasserstoff, Halogen, Cyano, Amino, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylcarbonyl, C₁-C₄-Halogenalkylcarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl-C₁-C₄-alkylthio, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkoxy, Di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl-C₁-C₄-alkylthio, C₃-C₈-Cycloalkyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, 3-, 4-, 5-, 6- oder 7-gliedriges Heterocyclyl, das ein oder zwei Ring-Heteroatome, ausgewählt unter Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel, aufweist.
5. 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone nach einem der Ansprüche 2 bis 4, worin R¹ für Chlor steht.
- 45 6. 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone nach einem der Ansprüche 2 bis 5, worin R³ für Trifluormethyl steht.

107

7. 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone nach einem der Ansprüche 2 bis 6, worin R^2 und $R^{2'}$ unabhängig voneinander Wasserstoff oder Methyl bedeuten.
- 5 8. 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone nach einem der Ansprüche 2 bis 7, worin R^5 ausgewählt ist unter Halogen oder Cyano.
9. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens
10 eines 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridons der in Anspruch 1 definierten Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und mindestens einen inerten flüssigen und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens einen oberflächenaktiven Stoff.
- 15 10. Mittel zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen, enthaltend eine desikkant und/oder defoliant wirksame Menge mindestens eines 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridons der in Anspruch 1 definierten Formel I oder eines landwirtschaftlich
20 brauchbaren Salzes von I, gemäß Anspruch 1, und mindestens einen inerten flüssigen und/oder festen Trägerstoff sowie gewünschtenfalls mindestens einen oberflächenaktiven Stoff.
11. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs,
25 dadurch gekennzeichnet, dass man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridons der in Anspruch 1 definierten Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I auf Pflanzen, deren Lebensraum oder auf Saatgut einwirken lässt.
- 30 12. Verfahren zur Desikkation und/oder Defoliation von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, dass man eine desikkant und/oder defoliant wirksame Menge mindestens eines 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridons der in Anspruch 1 definierten Formel I
35 oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I auf Pflanzen einwirken lässt.
13. Verfahren nach Anspruch 12, dadurch gekennzeichnet, dass man Baumwolle behandelt.
- 40 14. Verbindungen der allgemeinen Formel II zur Herstellung der 1-Aryl-4-halogenalkyl-2-[1H]-pyridone,

108



- 10 worin R^3 , X und Q die in Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und R^{2a} , $R^{2a'}$, R^{4a} , R^{5a} , R^{6a} für R^2 , $R^{2'}$, R^4 , R^5 und R^6 mit den in Anspruch 1 genannten Bedeutungen stehen, ausgenommen Verbindungen der allgemeinen Formel II, worin Q für CH steht, R^3 und R^{5a} Trifluormethyl bedeuten und R^{2a} , $R^{2a'}$, R^{4a} und $X-R^{6a}$ Wasserstoff bedeuten;
- 15 weiterhin ausgenommen Verbindungen der allgemeinen Formel II, worin Q für N steht, R^3 und R^{4a} die für R^3 bzw. R^4 in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, R^{2a} und $R^{2a'}$ Wasserstoff bedeuten, $X-R^{6a}$ für Wasserstoff oder Halogen stehen, wenn R^{5a} Trifluormethyl bedeutet,
- 20 weiterhin ausgenommen Verbindungen der allgemeinen Formel II mit $Q = CH$ und $R^3 = \text{Trifluormethyl}$, wenn R^{2a} , $R^{2a'}$ und R^{4a} Wasserstoff bedeuten, R^{5a} die für R^5 in Anspruch 1 angegebene Bedeutung hat, X eine Einfachbindung bedeutet und R^6 für eine Gruppe $S(O)_n-YR^8$ steht mit $n = 0, 1$ oder 2 , worin Y eine Einfachbindung bedeutet und R^8 ausgewählt ist unter n-Propyl,
- 25 Isopropyl, Cyclopropylmethyl und 2,2,2-Trifluorethyl, sowie die Tautomeren der Verbindungen II.

30

35

40

45

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 01/08251

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D213/64 C07D213/69 C07D413/04 C07D417/04 A01N43/76
 A01N43/78 A01N43/40

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 259 048 A (ICI PLC) 9 March 1988 (1988-03-09) cited in the application table I ---	1
X	EP 0 216 541 A (ICI PLC) 1 April 1987 (1987-04-01) table I ---	1
X	WO 99 55668 A (ASAHIDA MITSU HARU ; FUJISAWA TOYOKAZU (JP); IHARA CHEMICAL IND CO ()) 4 November 1999 (1999-11-04) cited in the application -& EP 1 076 053 A (IHARA CHEMICAL IND CO) 14 February 2001 (2001-02-14) tables 24,25 --- -/--	1

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

* & * document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

16 November 2001

Date of mailing of the international search report

27/11/2001

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Seitner, I

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 01/08251

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 272 824 A (ICI PLC) 29 June 1988 (1988-06-29) examples 1-3, 5-7; table I ----	1
X	WO 98 28980 A (ANTHONY NEVILLE J ; GOMEZ ROBERT P (US); MERCK & CO INC (US); TRAN) 9 July 1998 (1998-07-09) page 85, line 1 ----	1
Y	EP 0 488 220 A (SUMITOMO CHEMICAL CO) 3 June 1992 (1992-06-03) cited in the application claim 13; table I ----	1, 9
Y	EP 0 003 805 A (BASF AG) 5 September 1979 (1979-09-05) page 3 -page 5; claim 7 ----	1, 9
Y	DE 28 30 700 A (ROHM & HAAS) 1 February 1979 (1979-02-01) page 4; table 1 ----	1, 9
Y	EP 0 885 885 A (IHARA CHEMICAL IND CO ; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO (JP)) 23 December 1998 (1998-12-23) claim 9; table 1 ----	1, 9
Y	EP 0 415 642 A (ROHM & HAAS) 6 March 1991 (1991-03-06) example 1; table I example 14; table II claims 7-10 -----	1, 9

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/08251

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0259048	A	09-03-1988	AU 6138490 A	13-12-1990
			AU 602912 B2	01-11-1990
			AU 7719287 A	10-03-1988
			BR 8704518 A	19-04-1988
			CN 87106573 A	27-07-1988
			EP 0259048 A2	09-03-1988
			HU 44900 A2	30-05-1988
			IL 83612 A	15-07-1992
			JP 63068566 A	28-03-1988
			KR 9005389 B1	28-07-1990
			NZ 221475 A	26-10-1990
			PT 85648 A	14-10-1988
			US 4866078 A	12-09-1989
			US 5039807 A	13-08-1991
			ZA 8706159 A	03-03-1988
EP 0216541	A	01-04-1987	AU 614670 B2	05-09-1991
			AU 4249889 A	05-04-1990
			AU 591704 B2	14-12-1989
			AU 6259486 A	26-03-1987
			BR 8604499 A	19-05-1987
			CA 1273937 A1	11-09-1990
			CA 1278576 A2	02-01-1991
			CA 1276182 A2	13-11-1990
			CN 86106734 A	01-04-1987
			EG 17943 A	30-11-1991
			EP 0216541 A1	01-04-1987
			ES 2001694 A6	01-06-1988
			GB 2183634 A	10-06-1987
			GR 862336 A1	23-12-1986
			HU 199372 B	28-02-1990
			HU 41957 A2	29-06-1987
			IL 79982 A	31-08-1990
			JP 62070362 A	31-03-1987
			KR 9005369 B1	28-07-1990
			NZ 217511 A	29-05-1989
			PT 83397 A ,B	01-10-1986
			US 4725607 A	16-02-1988
			ZA 8606777 A	27-05-1987
WO 9955668	A	04-11-1999	AU 3536699 A	16-11-1999
			EP 1076053 A1	14-02-2001
			WO 9955668 A1	04-11-1999
			JP 2000198768 A	18-07-2000
EP 0272824	A	29-06-1988	AU 606368 B2	07-02-1991
			AU 8264187 A	14-07-1988
			EP 0272824 A2	29-06-1988
			JP 63170362 A	14-07-1988
			ZA 8709235 A	24-06-1988
WO 9828980	A	09-07-1998	AU 6013998 A	31-07-1998
			EP 1003374 A1	31-05-2000
			WO 9828980 A1	09-07-1998
			US 6093737 A	25-07-2000
EP 0488220	A	03-06-1992	EP 0488220 A2	03-06-1992
			JP 5170739 A	09-07-1993

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/08251

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0488220	A	US 5238906 A	24-08-1993
EP 0003805	A	05-09-1979	
		DE 2808193 A1	06-09-1979
		AR 222989 A1	15-07-1981
		AT 363276 B	27-07-1981
		AT 141579 A	15-12-1980
		AU 520536 B2	04-02-1982
		AU 4454879 A	20-09-1979
		BR 7900964 A	25-09-1979
		CA 1111426 A1	27-10-1981
		CS 207776 B2	31-08-1981
		DD 141606 A5	14-05-1980
		DE 2963211 D1	19-08-1982
		DK 76279 A	26-08-1979
		EP 0003805 A1	05-09-1979
		ES 478016 A1	01-12-1979
		GR 66793 A1	29-04-1981
		HU 180676 B	29-04-1983
		IL 56493 A	15-06-1983
		IN 150199 A1	14-08-1982
		JP 54130590 A	09-10-1979
		NZ 189755 A	23-01-1981
		PL 213648 A1	19-11-1979
		PT 69185 A ,B	01-03-1979
		TR 19943 A	02-05-1980
		US 4411691 A	25-10-1983
		ZA 7807240 A	30-01-1980
DE 2830700	A	01-02-1979	
		AR 218070 A1	15-05-1980
		AU 521772 B2	29-04-1982
		AU 3802578 A	17-01-1980
		BE 868999 A1	15-01-1979
		CA 1085857 A1	16-09-1980
		CH 635324 A5	31-03-1983
		DE 2830700 A1	01-02-1979
		DK 318578 A ,B,	16-01-1979
		ES 471780 A1	16-01-1979
		FR 2397405 A1	09-02-1979
		GB 1596887 A	03-09-1981
		HU 181943 B	28-11-1983
		IL 55133 A	30-11-1982
		IT 1108115 B	02-12-1985
		JP 54052084 A	24-04-1979
		NL 7807464 A ,B,	17-01-1979
		NZ 187735 A	16-03-1981
		SE 436568 B	07-01-1985
		SE 7807006 A	16-01-1979
		US 4238220 A	09-12-1980
EP 0885885	A	23-12-1998	
		AU 1555897 A	22-08-1997
		EP 0885885 A1	23-12-1998
		US 6048823 A	11-04-2000
		WO 9728127 A1	07-08-1997
		US 6265349 B1	24-07-2001
EP 0415642	A	06-03-1991	
		AT 131156 T	15-12-1995
		AU 638482 B2	01-07-1993
		AU 6202090 A	07-03-1991

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/08251

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0415642	A	BR 9004333 A	03-09-1991
		CA 2023492 A1	01-03-1991
		CN 1049846 A ,B	13-03-1991
		DE 69023987 D1	18-01-1996
		DE 69023987 T2	10-10-1996
		DK 415642 T3	02-01-1996
		EP 0415642 A1	06-03-1991
		ES 2081939 T3	16-03-1996
		GR 3018421 T3	31-03-1996
		HU 54461 A2	28-03-1991
		IE 903148 A1	13-03-1991
		JP 3163060 A	15-07-1991
		KR 196790 B1	15-06-1999
		NO 903758 A	01-03-1991
		NZ 235090 A	25-06-1996
		PT 95173 A ,B	22-05-1991
		US 5502027 A	26-03-1996
		US 5631209 A	20-05-1997
		ZA 9006838 A	26-06-1991
		US 5393735 A	28-02-1995

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 272 824 A (ICI PLC) 29. Juni 1988 (1988-06-29) Beispiele 1-3,5-7; Tabelle I ----	1
X	WO 98 28980 A (ANTHONY NEVILLE J ; GOMEZ ROBERT P (US); MERCK & CO INC (US); TRAN) 9. Juli 1998 (1998-07-09) Seite 85, Zeile 1 ----	1
Y	EP 0 488 220 A (SUMITOMO CHEMICAL CO) 3. Juni 1992 (1992-06-03) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 13; Tabelle I ----	1,9
Y	EP 0 003 805 A (BASF AG) 5. September 1979 (1979-09-05) Seite 3 -Seite 5; Anspruch 7 ----	1,9
Y	DE 28 30 700 A (ROHM & HAAS) 1. Februar 1979 (1979-02-01) Seite 4; Tabelle 1 ----	1,9
Y	EP 0 885 885 A (IHARA CHEMICAL IND CO ; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO (JP)) 23. Dezember 1998 (1998-12-23) Anspruch 9; Tabelle 1 ----	1,9
Y	EP 0 415 642 A (ROHM & HAAS) 6. März 1991 (1991-03-06) Beispiel 1; Tabelle I Beispiel 14; Tabelle II Ansprüche 7-10 -----	1,9

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/08251

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0259048	A	09-03-1988	AU 6138490 A 13-12-1990
			AU 602912 B2 01-11-1990
			AU 7719287 A 10-03-1988
			BR 8704518 A 19-04-1988
			CN 87106573 A 27-07-1988
			EP 0259048 A2 09-03-1988
			HU 44900 A2 30-05-1988
			IL 83612 A 15-07-1992
			JP 63068566 A 28-03-1988
			KR 9005389 B1 28-07-1990
			NZ 221475 A 26-10-1990
			PT 85648 A 14-10-1988
			US 4866078 A 12-09-1989
			US 5039807 A 13-08-1991
			ZA 8706159 A 03-03-1988
EP 0216541	A	01-04-1987	AU 614670 B2 05-09-1991
			AU 4249889 A 05-04-1990
			AU 591704 B2 14-12-1989
			AU 6259486 A 26-03-1987
			BR 8604499 A 19-05-1987
			CA 1273937 A1 11-09-1990
			CA 1278576 A2 02-01-1991
			CA 1276182 A2 13-11-1990
			CN 86106734 A 01-04-1987
			EG 17943 A 30-11-1991
			EP 0216541 A1 01-04-1987
			ES 2001694 A6 01-06-1988
			GB 2183634 A 10-06-1987
			GR 862336 A1 23-12-1986
			HU 199372 B 28-02-1990
			HU 41957 A2 29-06-1987
			IL 79982 A 31-08-1990
			JP 62070362 A 31-03-1987
			KR 9005369 B1 28-07-1990
			NZ 217511 A 29-05-1989
			PT 83397 A ,B 01-10-1986
			US 4725607 A 16-02-1988
			ZA 8606777 A 27-05-1987
WO 9955668	A	04-11-1999	AU 3536699 A 16-11-1999
			EP 1076053 A1 14-02-2001
			WO 9955668 A1 04-11-1999
			JP 2000198768 A 18-07-2000
EP 0272824	A	29-06-1988	AU 606368 B2 07-02-1991
			AU 8264187 A 14-07-1988
			EP 0272824 A2 29-06-1988
			JP 63170362 A 14-07-1988
			ZA 8709235 A 24-06-1988
WO 9828980	A	09-07-1998	AU 6013998 A 31-07-1998
			EP 1003374 A1 31-05-2000
			WO 9828980 A1 09-07-1998
			US 6093737 A 25-07-2000
EP 0488220	A	03-06-1992	EP 0488220 A2 03-06-1992
			JP 5170739 A 09-07-1993

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

I nales Aktenzeichen

PCT/EP 01/08251

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0488220	A	US 5238906 A	24-08-1993
EP 0003805	A	05-09-1979	
		DE 2808193 A1	06-09-1979
		AR 222989 A1	15-07-1981
		AT 363276 B	27-07-1981
		AT 141579 A	15-12-1980
		AU 520536 B2	04-02-1982
		AU 4454879 A	20-09-1979
		BR 7900964 A	25-09-1979
		CA 1111426 A1	27-10-1981
		CS 207776 B2	31-08-1981
		DD 141606 A5	14-05-1980
		DE 2963211 D1	19-08-1982
		DK 76279 A	26-08-1979
		EP 0003805 A1	05-09-1979
		ES 478016 A1	01-12-1979
		GR 66793 A1	29-04-1981
		HU 180676 B	29-04-1983
		IL 56493 A	15-06-1983
		IN 150199 A1	14-08-1982
		JP 54130590 A	09-10-1979
		NZ 189755 A	23-01-1981
		PL 213648 A1	19-11-1979
		PT 69185 A ,B	01-03-1979
		TR 19943 A	02-05-1980
		US 4411691 A	25-10-1983
		ZA 7807240 A	30-01-1980
DE 2830700	A	01-02-1979	
		AR 218070 A1	15-05-1980
		AU 521772 B2	29-04-1982
		AU 3802578 A	17-01-1980
		BE 868999 A1	15-01-1979
		CA 1085857 A1	16-09-1980
		CH 635324 A5	31-03-1983
		DE 2830700 A1	01-02-1979
		DK 318578 A ,B,	16-01-1979
		ES 471780 A1	16-01-1979
		FR 2397405 A1	09-02-1979
		GB 1596887 A	03-09-1981
		HU 181943 B	28-11-1983
		IL 55133 A	30-11-1982
		IT 1108115 B	02-12-1985
		JP 54052084 A	24-04-1979
		NL 7807464 A ,B,	17-01-1979
		NZ 187735 A	16-03-1981
		SE 436568 B	07-01-1985
		SE 7807006 A	16-01-1979
		US 4238220 A	09-12-1980
EP 0885885	A	23-12-1998	
		AU 1555897 A	22-08-1997
		EP 0885885 A1	23-12-1998
		US 6048823 A	11-04-2000
		WO 9728127 A1	07-08-1997
		US 6265349 B1	24-07-2001
EP 0415642	A	06-03-1991	
		AT 131156 T	15-12-1995
		AU 638482 B2	01-07-1993
		AU 6202090 A	07-03-1991

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 01/08251

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0415642 A		BR 9004333 A	03-09-1991
		CA 2023492 A1	01-03-1991
		CN 1049846 A ,B	13-03-1991
		DE 69023987 D1	18-01-1996
		DE 69023987 T2	10-10-1996
		DK 415642 T3	02-01-1996
		EP 0415642 A1	06-03-1991
		ES 2081939 T3	16-03-1996
		GR 3018421 T3	31-03-1996
		HU 54461 A2	28-03-1991
		IE 903148 A1	13-03-1991
		JP 3163060 A	15-07-1991
		KR 196790 B1	15-06-1999
		NO 903758 A	01-03-1991
		NZ 235090 A	25-06-1996
		PT 95173 A ,B	22-05-1991
		US 5502027 A	26-03-1996
		US 5631209 A	20-05-1997
		ZA 9006838 A	26-06-1991
		US 5393735 A	28-02-1995